

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平11-60562

(43) 公開日 平成11年(1999) 3月2日

| (51) Int.Cl. ⁵ | 識別記号 | F I |
|---------------------------|-------|-----------------|
| C 0 7 D 239/52 | | C 0 7 D 239/52 |
| A 0 1 N 43/54 | | A 0 1 N 43/54 B |
| 43/60 | | 43/60 |
| 43/84 | 1 0 1 | 43/84 1 0 1 |
| C 0 7 D 239/60 | | C 0 7 D 239/60 |

審査請求 未請求 請求項の数 3 F D (全 57 頁) 最終頁に続く

| | | | |
|--------------|------------------|----------|---|
| (21) 出願番号 | 特願平10-173980 | (71) 出願人 | 000000169 クミアイ化学工業株式会社 東京都台東区池之端 1 丁目 4 番 26 号 |
| (22) 出願日 | 平成10年(1998) 6月5日 | (71) 出願人 | 000102049 イハラケミカル工業株式会社 東京都台東区池之端 1 丁目 4 番 26 号 |
| (31) 優先権主張番号 | 特願平9-169454 | (72) 発明者 | 吉村 巧 静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の 1 株式会社ケイ・アイ研究所内 |
| (32) 優先日 | 平 9 (1997) 6月11日 | (72) 発明者 | 宮崎 雅弘 静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の 1 株式会社ケイ・アイ研究所内 |
| (33) 優先権主張国 | 日本 (J P) | | |

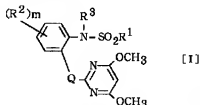
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 スルホンアニリド誘導体及び除草剤

(57) 【要約】

【課題】 水田における有害雑草に対して優れた除草効果をもつとともに作物に安全性が高いスルホンアニリド誘導体を提供する。

【解決手段】 一般式 [I]



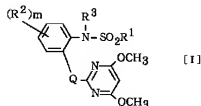
{式中、R¹ はアルキル基又はアルケニル基〔該基はいずれもハロゲン原子等で置換されてもよい。〕を示し、R² は水素原子、ハロゲン原子又はアルコキシ基等を示し、R³ は水素原子、アルキル基又はアルコシカルボニル基等を示し、Qは基-CH (NR⁴ R⁵) -〔ここでR⁴、R⁵ は水素原子、アルキル基等を示す。〕又は基-C (=NR⁶) -〔ここでR⁶ は水素原子、アルキル基等を示す。〕を示し、mは1〜4の整数を示す。}で示されるスルホンアニリド誘導体及びその塩、該スル

ホンアニリド誘導体を有効成分として含有する除草剤。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式〔I〕

【化1】

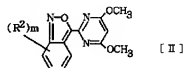


〔式中、R¹ はアルキル基（該基はハロゲン原子又はシアノ基で置換されてもよい。）又はアルケニル基（該基はハロゲン原子で置換されてもよい。）を示し、R² は各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、アルコキシ基又はアルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、アルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキルニルオキシ基、アルキルチオ基、モノ又はジアルキルアミノ基で置換されてもよい。）を示し、R³ は水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、アルケニルオキシ基、アルキルニルオキシ基、モノ又はジアルキルアミノ基、アルコキシ基又はアルキルチオ基で置換されてもよい。））、ベンジル基、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基又は基-SO₂R¹（ここでR¹ は前記と同じ意味を示す。）を示し、Qは基-CH(NR⁴R⁵)-〔ここでR⁴、R⁵ は同一か又は相異なり、水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基又はフェニル基で置換されてもよい。））、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基で置換されてもよい。））、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基、基-SO₂R¹（ここでR¹ は前記と同じ意味を示す。））、基-NR⁷R⁸〔ここでR⁷、R⁸ は同一か又は相異なり、水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基又はフェニル基で置換されてもよい。））、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基で置換されてもよい。））、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基又は置換されたチオカルバモイル基を示す。〕又は基-OR⁹〔ここでR⁹ は水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基、フェニル基で置換されてもよい。））、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基で置換されてもよい。））、アシル基、アルコキシカルボニル基、アルキルスルホニル基（該基はハロゲン原子で置換されてもよい。））、置換されたカルバモイル基又は置換

されたチオカルバモイル基を示す。〕を示し、或いは場合により、R⁴ 及びR⁵ はこれらの結合した窒素原子と合わせて一つ又はそれ以上のヘテロ原子を有する含窒素ヘテロ環系を形成してもよい。〕又は基-C(=N R⁶)-〔ここでR⁶ は水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基、フェニル基で置換されてもよい。））、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基で置換されてもよい。））、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基、基-SO₂R¹（ここでR¹ は前記と同じ意味を示す。））、基-NR⁷R⁸（ここでR⁷ 及びR⁸ は前記と同じ意味を示す。）又は基-OR⁹（ここでR⁹ は前記と同じ意味を示す。）を示す。〕を示し、mは1～4の整数を示す。〕で示されるスルホンアニリド誘導体及びその塩。

【請求項2】 一般式〔II〕

【化2】



〔式中、R² 及びmは請求項1に記載と同じ意味を示す。〕で示される請求項1に記載のスルホンアニリド誘導体の製造中間体である4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イール誘導体。

【請求項3】 請求項1に記載のスルホンアニリド誘導体又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする除草剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明は新規なスルホンアニリド誘導体およびそれを有効成分として含有することを特徴とする除草剤に関するものである。

【0002】

【従来技術】特発平7-501053号公報明細書及びW096/41799号公報明細書にはアニリドの2'位にピリミジン-2-イール基が置換したスルホンアニリド化合物が除草活性を有することが記載されている。

【0003】しかしながら、該公報明細書の中には、アニリドの2'位へのピリミジン-2-イール基の置換において、ピリミジン2位とアニリド2'位との結合が、メチレン基、ハロゲン置換メチレン基、カルボニル基、ヒドロキシル基、オキシメチレン基、アルコキシ基、チオキシメチレン基又はアルキルチオ基である化合物及びそれらの誘導体が記載されているものの、本発明スルホンアニリド誘導体のように、ピリミジン2位とアニリドの2'位との結合にアリメチレン基、イミノメチレン基

を有する化合物については知られていない。即ち、本発明スルホンアニリド誘導体およびそれを有効成分とする除草剤について具体的な除草効果や製造法は今まで知られていない。更に特表7-501053号公報明細書及びWO96/41799号公報明細書に記載の化合物は除草活性が不十分であったり、作物と雑草間の選択性に劣ることから満足すべきものとは言い難い。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】現在、水田においてはカヤツリグサ科雑草等、種々の難防除雑草が問題になっている。これらの雑草は発生が不揃いで、しかも水稻の栽培時期に長期間に渡って発生してくるため、その防除は難しい課題となっている。このため、それらを防除できる処理適期幅の広い薬剤の開発が望まれている。また、現在、水稻除草剤では、葉齢の小さい水稻や移植深度の浅い水稻に対しても安全に除草剤を使用することは、極めて難しい課題となっている。特に水稻に対し高い安全性を有する除草剤の出現は、移植時に除草剤の同時処理を可能にし、稲作作業の合理化、大型化にとって大いに切望されている。

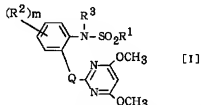
【0005】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、このような状況に鑑み種々検討した結果、新規なスルホンアニリド誘導体とその製造方法を案出し、該化合物が上述のような欠点の少ない優れた除草作用を有することを見出し、本発明を完成するに至った。

【0006】即ち、本発明は(1)一般式【I】

【0007】

【化3】

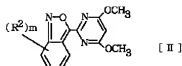


(式中、R¹はアルキル基(該基はハロゲン原子又はシアン基で置換されてもよい。))又はアルケニル基(該基はハロゲン原子で置換されてもよい。))を示し、R²は各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、アルコキシ基又はアルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、アルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキルオキシ基、アルキルチオ基、モノ又はジアルキルアミノ基で置換されてもよい。))を示し、R³は水素原子、アルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、アルケニルオキシ基、アルキルオキシ基、モノ又はジアルキルアミノ基、アルコキシ基又はアルキルチオ基で置換されてもよい。)、ベンジル基、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基又は基-SO₂R¹(ここでR¹は前記と同じ意味を示す。))を示し、Qは基-CH(R⁴R⁵)-[ここで

R⁴、R⁵は同一か又は相異なり、水素原子、アルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、シアン基、アルコキシ基、アルキルチオ基又はフェニル基で置換されてもよい。))、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基(該基はハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基で置換されてもよい。)、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基、基-SO₂R¹(ここでR¹は前記と同じ意味を示す。)、基-NR⁷R⁸(ここでR⁷、R⁸は同一か又は相異なり、水素原子、アルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、シアン基、アルコキシ基、アルキルチオ基又はフェニル基で置換されてもよい。))、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基(該基はハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基で置換されてもよい。)、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基又は置換されたチオカルバモイル基を示す。]又は基-OR⁹(ここでR⁹は水素原子、アルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、シアン基、アルコキシ基、アルキルチオ基、フェニル基で置換されてもよい。))、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基(該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基で置換されてもよい。)、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基、基-SO₂R¹(ここでR¹は前記と同じ意味を示す。)、基-NR⁷R⁸(ここでR⁷及びR⁸は前記と同じ意味を示す。))又は基-OR⁹(ここでR⁹は前記と同じ意味を示す。))を示す。]を示し、mは1~4の整数を示す。}で示されるスルホンアニリド誘導体及びその塩、(2)一般式【I】で示される化合物の製造中間体となる一般式【II】

【0008】

【化4】



[II]

(式中、 R^2 及び m は前記と同じ意味を示す。)で示される4, 6-ジメトキシピリジン-2-イル誘導体及び、(3)-一般式[1]記載のスルホンアミド誘導体又はその塩を有効成分とする除草剤を提供するものである。

【0009】尚、本明細書において、用いられる用語の定義を以下に示す。

【0010】ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子を示す。

【0011】アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が1〜10の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を意味し、例えばメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ペンチル基、イソアミル基、ネオペンチル基、*n*-ヘキシル基、イソヘキシル基、3, 3-ジメチルブチル基、*n*-ヘプチル基、*n*-オクチル基、*n*-ノニル基、*n*-デシル基等を挙げることができる。

【0012】アシル基とは、ホルミル基、ベンゾイル基又はアルキル部分が上記の意味を示す(アルキル)-C O-基を示し、例えばアセチル基、プロピオニル基等を挙げることができる。

【0013】アルコキシ基とは、アルキル部分が上記の意味を示す(アルキル)-O-基を示し、例えばメトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、イソプロポキシ基、*n*-ブトキシ基、イソブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基、*n*-オクチルオキシ基等を挙げることができる。

【0014】アルコキシカルボニル基とは、アルコキシ部分が上記の意味を示す(アルコキシ)-C O-基を示し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0015】アルケニル基とは、炭素数が2〜6の直鎖又は分岐鎖状のアルケニル基を示し、例えばビニル基、プロペニル基等を挙げることができる。

【0016】アルケニルオキシ基とは、アルケニル部分が上記の意味を示す(アルケニル)-O-基を示し、例えばアリルオキシ基等を挙げることができる。

【0017】アルキル基とは、炭素数が2〜6の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばプロパルギル基等を挙げることができる。

【0018】アルキニルオキシ基とは、アルキニル部分が上記の意味を示す(アルキニル)-O-基を示し、例えばプロパルギルオキシ基等を挙げることができる。

【0019】シクロアルキル基とは、炭素数3〜7のシ

クロアルキル基を示し、例えばシクロプロピル基、シクロペンチル基等を挙げることができる。

【0020】アルキルチオ基及びアルキルスルホニル基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)-S-基、(アルキル)-S O₂-基を示し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0021】モノ又はジアルキルアミノ基とは、アルキル部分が上記の意味である、(アルキル)-NH-基、(アルキル)₂N-基を示し、例えばメチルアミノ基、ジメチルアミノ基等を挙げることができる。

【0022】置換されたカルバモイル基とは、*N*-モノ置換又は*N*, *N*-ジ置換されたカルバモイル基を示し、例えば*N*, *N*-ジメチルカルバモイル基等を挙げることができる。

【0023】置換されたチオカルバモイル基とは、*N*-モノ置換又は*N*, *N*-ジ置換されたチオカルバモイル基を示し、例えば*N*-メチルチオカルバモイル基等を挙げることができる。

【0024】アシルオキシ基及びアルキルスルホニルオキシ基とは、アシル又はアルキルスルホニル部分がそれぞれ上記の意味である(アシル)-O-基、(アルキルスルホニル)-O-基を示し、例えばアセトキシ基又はメシルオキシ基等を挙げることができる。

【0025】含窒素ヘテロ環基とは、5〜6員環の含窒素ヘテロ環基を示し、例えばピリジノ基、モルホリノ基、イミダゾリル基等を挙げることができる。

【0026】塩とは、一般式[1]で表される化合物と酸との塩又は、一般式[1]で表される化合物の、スルホンアミドと金属或いは有機塩基との塩であり、酸としては塩酸や炭化水素酸等のハロゲン化水素酸又は硫酸やメタンスルホン酸等のスルホン酸を挙げることができ、金属としてはナトリウムやカリウム等のアルカリ金属、マグネシウムやカルシウム等のアルカリ土類金属を挙げることができ、有機塩基としてはトリエチルアミン、ジイソプロピルアミン等を挙げることができる。

【0027】前記一般式[1]において、好ましい化合物群としては、 R^1 がトリフルオロメチル基又はジフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、炭素数が1〜3のアルキル基及び炭素数が1〜3のアルコキシ基、ハロゲン原子又はメトキシメチル基であり、 R^3 が水素原子又はメトキシメチル基であり、 Q が基-CH($N R^4 R^5$)-であり、 R^4 、 R^5 は同一か又は相異なり、水素原子又は炭素数が1〜6のアルキル基であり、 m が1又は2で表される化合物群が挙げられる。

【0028】

【発明の実施の形態】次に、一般式[1]、[1']で表される本発明化合物の代表的な化合物例を表1〜表3に示すが、本発明化合物はこれらに限られるものではない。尚、化合物番号は以後の記載において参照され

る。

【0029】本明細書における表中の次の表記は下記の

Me : メチル基、
 Pr : プロピル基、
 Bu : ブチル基、
 Bu-s : sec-ブチル基、
 Pen : n-ペンチル基、
 Pr-c : シクロプロピル基、
 Pen-c : シクロペンチル基、

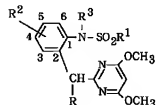
通りそれぞれ該当する基を表す。

【0030】

Et : エチル基、
 Pr-i : イソプロピル基、
 Bu-i : イソブチル基、
 Bu-t : tert-ブチル基、
 Bn : ベンジル基、
 Bu-c : シクロブチル基、
 Ph : フェニル基、

【0031】

【表1】



| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 比出屈折 率(n _D ²⁰) |
|------------|-------------------|----------------|----------------|--------------------|--|
| 1-1 | CH ₃ F | H | H | N(Et) ₂ | 137-138 |
| 1-2 | CH ₃ F | H | H | N(Pr) ₂ | 1.5350 |
| 1-3 | CH ₃ F | H | H | N(Me) ₂ | 94-95 |
| 1-4 | CH ₃ F | H | H | NHEt | 135-137 |
| 1-5 | CH ₃ F | H | H | NHPr | |
| 1-6 | CH ₃ F | H | H | NHPr-i | |
| 1-7 | CH ₃ F | H | H | NHMe | 174-175 |
| 1-8 | CH ₃ F | 3-F | H | N(Et) ₂ | |
| 1-9 | CH ₃ F | 3-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-10 | CH ₃ F | 3-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-11 | CH ₃ F | 3-F | H | NHEt | |
| 1-12 | CH ₃ F | 3-F | H | NHPr | |
| 1-13 | CH ₃ F | 3-F | H | NHPr-i | |
| 1-14 | CH ₃ F | 3-F | H | NHMe | |
| 1-15 | CH ₃ F | 5-F | H | N(Et) ₂ | |
| 1-16 | CH ₃ F | 5-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-17 | CH ₃ F | 5-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-18 | CH ₃ F | 5-F | H | NHEt | |
| 1-19 | CH ₃ F | 5-F | H | NHPr | |
| 1-20 | CH ₃ F | 5-F | H | NHPr-i | |
| 1-21 | CH ₃ F | 5-F | H | NHMe | |
| 1-22 | CH ₃ F | 6-Et | H | N(Et) ₂ | |
| 1-23 | CH ₃ F | 6-Et | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-24 | CH ₃ F | 6-Et | H | N(Me) ₂ | |
| 1-25 | CH ₃ F | 6-Et | H | NHEt | |

【0032】

【表2】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 比重量 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-------------------|----------------|----------------|--------------------|---|
| I-26 | CH ₂ F | 6-Bt | H | NHPr | |
| I-27 | CH ₂ F | 6-Bt | H | NHPr-i | |
| I-28 | CH ₂ F | 6-Bt | H | NHMe | |
| I-29 | CH ₂ F | 6-F | H | N(Et) ₂ | |
| I-30 | CH ₂ F | 6-F | H | N(Pr) ₂ | |
| I-31 | CH ₂ F | 6-F | H | N(Me) ₂ | |
| I-32 | CH ₂ F | 6-F | H | NHEt | |
| I-33 | CH ₂ F | 6-F | H | NHPr | |
| I-34 | CH ₂ F | 6-F | H | NHPr-i | |
| I-35 | CH ₂ F | 6-F | H | NHMe | |
| I-36 | CH ₂ F | 6-Me | H | N(Et) ₂ | |
| I-37 | CH ₂ F | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | |
| I-38 | CH ₂ F | 6-Me | H | N(Me) ₂ | |
| I-39 | CH ₂ F | 6-Me | H | NHEt | |
| I-40 | CH ₂ F | 6-Me | H | NHPr | |
| I-41 | CH ₂ F | 6-Me | H | NHPr-i | |
| I-42 | CH ₂ F | 6-Me | H | NHMe | |
| I-43 | CH ₂ F | 6-Me | H | N(Et) ₂ | |
| I-44 | CH ₂ F | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | |
| I-45 | CH ₂ F | 6-Me | H | N(Me) ₂ | |
| I-46 | CH ₂ F | 6-Me | H | NHEt | |
| I-47 | CH ₂ F | 6-Me | H | NHPr | |
| I-48 | CH ₂ F | 6-Me | H | NHPr-i | |
| I-49 | CH ₂ F | 6-Me | H | NHMe | |
| I-50 | CH ₂ F | 6-Pr | H | N(Et) ₂ | |
| I-51 | CH ₂ F | 6-Pr | H | N(Pr) ₂ | |
| I-52 | CH ₂ F | 6-Pr | H | N(Me) ₂ | |
| I-53 | CH ₂ F | 6-Pr | H | NHEt | |
| I-54 | CH ₂ F | 6-Pr | H | NHPr | |
| I-55 | CH ₂ F | 6-Pr | H | NHPr-i | |
| I-56 | CH ₂ F | 6-Pr | H | NHMe | |

【0033】

【表3】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 比之屈折 率(n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|-----------------------|----------------|--------------------|---|
| 1-57 | CH ₂ F | 6-CH ₂ OMe | H | N(Gt) ₂ | |
| 1-58 | CH ₂ F | 6-CH ₂ OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-59 | CH ₂ F | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 1-60 | CH ₂ F | 6-CH ₂ OMe | H | NHt | |
| 1-61 | CH ₂ F | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr | |
| 1-62 | CH ₂ F | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr-i | |
| 1-63 | CH ₂ F | 6-CH ₂ OMe | H | NEMe | |
| 1-64 | CH ₂ Br | H | H | N(Gt) ₂ | |
| 1-65 | CH ₂ Br | H | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-66 | CH ₂ Br | H | H | N(Me) ₂ | |
| 1-67 | CH ₂ Br | H | H | NHt | |
| 1-68 | CH ₂ Br | H | H | NHPr | |
| 1-69 | CH ₂ Br | H | H | NHPr-i | |
| 1-70 | CH ₂ Br | H | H | NEMe | |
| 1-71 | CH ₂ Br | 3-F | H | N(Gt) ₂ | |
| 1-72 | CH ₂ Br | 3-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-73 | CH ₂ Br | 3-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-74 | CH ₂ Br | 3-F | H | NHt | |
| 1-75 | CH ₂ Br | 3-F | H | NHPr | |
| 1-76 | CH ₂ Br | 3-F | H | NHPr-i | |
| 1-77 | CH ₂ Br | 3-F | H | NEMe | |
| 1-78 | CH ₂ Br | 5-F | H | N(Gt) ₂ | |
| 1-79 | CH ₂ Br | 5-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-80 | CH ₂ Br | 5-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-81 | CH ₂ Br | 5-F | H | NHt | |
| 1-82 | CH ₂ Br | 5-F | H | NHPr | |
| 1-83 | CH ₂ Br | 5-F | H | NHPr-i | |
| 1-84 | CH ₂ Br | 5-F | H | NEMe | |
| 1-85 | CH ₂ Br | 6-Et | H | N(Gt) ₂ | |
| 1-86 | CH ₂ Br | 6-Et | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-87 | CH ₂ Br | 6-Et | H | N(Me) ₂ | |
| 1-88 | CH ₂ Br | 6-Et | H | NHt | |

【0034】

【表4】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 比重量折 率(n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|----------------|----------------|--------------------|--|
| I-89 | CH ₂ Br | 6-Et | H | NHPr | |
| I-90 | CH ₂ Br | 6-Et | H | NHPr-i | |
| I-91 | CH ₂ Br | 6-Et | H | NHMe | |
| I-92 | CH ₂ Br | 6-F | H | N(Pr) ₂ | |
| I-93 | CH ₂ Br | 6-F | H | N(Pr) ₂ | |
| I-94 | CH ₂ Br | 6-F | H | N(Me) ₂ | |
| I-95 | CH ₂ Br | 6-F | H | NHEt | |
| I-96 | CH ₂ Br | 6-F | H | NHPr | |
| I-97 | CH ₂ Br | 6-F | H | NHPr-i | |
| I-98 | CH ₂ Br | 6-F | H | NHMe | |
| I-99 | CH ₂ Br | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | |
| I-100 | CH ₂ Br | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | |
| I-101 | CH ₂ Br | 6-Me | H | N(Me) ₂ | |
| I-102 | CH ₂ Br | 6-Me | H | NHEt | |
| I-103 | CH ₂ Br | 6-Me | H | NHPr | |
| I-104 | CH ₂ Br | 6-Me | H | NHPr-i | |
| I-105 | CH ₂ Br | 6-Me | H | NHMe | |
| I-106 | CH ₂ Br | 6-OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| I-107 | CH ₂ Br | 6-OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| I-108 | CH ₂ Br | 6-OMe | H | N(Me) ₂ | |
| I-109 | CH ₂ Br | 6-OMe | H | NHEt | |
| I-110 | CH ₂ Br | 6-OMe | H | NHPr | |
| I-111 | CH ₂ Br | 6-OMe | H | NHPr-i | |
| I-112 | CH ₂ Br | 6-OMe | H | NHMe | |
| I-113 | CH ₂ Br | 6-Pr | H | N(Pr) ₂ | |
| I-114 | CH ₂ Br | 6-Pr | H | N(Pr) ₂ | |
| I-115 | CH ₂ Br | 6-Pr | H | N(Me) ₂ | |
| I-116 | CH ₂ Br | 6-Pr | H | NHEt | |
| I-117 | CH ₂ Br | 6-Pr | H | NHPr | |
| I-118 | CH ₂ Br | 6-Pr | H | NHPr-i | |
| I-119 | CH ₂ Br | 6-Pr | H | NHMe | |

【0035】

【表5】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 比重量折 率(n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|-----------------------|----------------|--------------------|--|
| 1-120 | CH ₂ Br | 6-CH ₂ OMe | H | N(St) ₂ | |
| 1-121 | CH ₂ Br | 6-CH ₂ OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-122 | CH ₂ Br | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 1-123 | CH ₂ Br | 6-CH ₂ OMe | H | NHEt | |
| 1-124 | CH ₂ Br | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr | |
| 1-125 | CH ₂ Br | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr-i | |
| 1-126 | CH ₂ Br | 6-CH ₂ OMe | H | NMe | |
| 1-127 | CH ₂ Cl | H | H | N(St) ₂ | |
| 1-128 | CH ₂ Cl | H | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-129 | CH ₂ Cl | H | H | N(Me) ₂ | |
| 1-130 | CH ₂ Cl | H | H | NHEt | |
| 1-131 | CH ₂ Cl | H | H | NHPr | |
| 1-132 | CH ₂ Cl | H | H | NHPr-i | |
| 1-133 | CH ₂ Cl | H | H | NMe | |
| 1-134 | CH ₂ Cl | 3-F | H | N(St) ₂ | |
| 1-135 | CH ₂ Cl | 3-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-136 | CH ₂ Cl | 3-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-137 | CH ₂ Cl | 3-F | H | NHEt | |
| 1-138 | CH ₂ Cl | 3-F | H | NHPr | |
| 1-139 | CH ₂ Cl | 3-F | H | NHPr-i | |
| 1-140 | CH ₂ Cl | 3-F | H | NMe | |
| 1-141 | CH ₂ Cl | 5-F | H | N(St) ₂ | |
| 1-142 | CH ₂ Cl | 5-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-143 | CH ₂ Cl | 5-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-144 | CH ₂ Cl | 5-F | H | NHEt | |
| 1-145 | CH ₂ Cl | 5-F | H | NHPr | |
| 1-146 | CH ₂ Cl | 5-F | H | NHPr-i | |
| 1-147 | CH ₂ Cl | 5-F | H | NMe | |
| 1-148 | CH ₂ Cl | 6-Et | H | N(St) ₂ | |
| 1-149 | CH ₂ Cl | 6-Et | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-150 | CH ₂ Cl | 6-Et | H | N(Me) ₂ | |
| 1-151 | CH ₂ Cl | 6-Et | H | NHEt | |

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 及折光率(n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|----------------|----------------|--------------------|---|
| 1-152 | CH ₂ Cl | 6-Et | H | NHPr | |
| 1-153 | CH ₂ Cl | 6-Et | H | NHPr-i | |
| 1-154 | CH ₂ Cl | 6-Et | H | NHMe | |
| 1-155 | CH ₂ Cl | 6-F | H | N(Bt) ₂ | |
| 1-156 | CH ₂ Cl | 6-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-157 | CH ₂ Cl | 6-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-158 | CH ₂ Cl | 6-F | H | NHSt | |
| 1-159 | CH ₂ Cl | 6-F | H | NHPr | |
| 1-160 | CH ₂ Cl | 6-F | H | NHPr-i | |
| 1-161 | CH ₂ Cl | 6-F | H | NHMe | |
| 1-162 | CH ₂ Cl | 6-Me | H | N(Bt) ₂ | |
| 1-163 | CH ₂ Cl | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-164 | CH ₂ Cl | 6-Me | H | N(Me) ₂ | |
| 1-165 | CH ₂ Cl | 6-Me | H | NHSt | |
| 1-166 | CH ₂ Cl | 6-Me | H | NHPr | |
| 1-167 | CH ₂ Cl | 6-Me | H | NHPr-i | |
| 1-168 | CH ₂ Cl | 6-Me | H | NHMe | |
| 1-169 | CH ₂ Cl | 6-OMe | H | N(Bt) ₂ | |
| 1-170 | CH ₂ Cl | 6-OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-171 | CH ₂ Cl | 6-OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 1-172 | CH ₂ Cl | 6-OMe | H | NHSt | |
| 1-173 | CH ₂ Cl | 6-OMe | H | NHPr | |
| 1-174 | CH ₂ Cl | 6-OMe | H | NHPr-i | |
| 1-175 | CH ₂ Cl | 6-OMe | H | NHMe | |
| 1-176 | CH ₂ Cl | 6-Pr | H | N(Bt) ₂ | |
| 1-177 | CH ₂ Cl | 6-Pr | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-178 | CH ₂ Cl | 6-Pr | H | N(Me) ₂ | |
| 1-179 | CH ₂ Cl | 6-Pr | H | NHSt | |
| 1-180 | CH ₂ Cl | 6-Pr | H | NHPr | |
| 1-181 | CH ₂ Cl | 6-Pr | H | NHPr-i | |
| 1-182 | CH ₂ Cl | 6-Pr | H | NHMe | |

【0037】

【表7】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点 (°C) または屈折 率 (n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|-----------------------|----------------|---------------------|--|
| 1-183 | CH ₂ Cl | 6-CH ₂ OMe | H | N (Et) ₂ | |
| 1-184 | CH ₂ Cl | 6-CH ₂ OMe | H | N (Pr) ₂ | |
| 1-185 | CH ₂ Cl | 6-CH ₂ OMe | H | N (Me) ₂ | |
| 1-186 | CH ₂ Cl | 6-CH ₂ OMe | H | NHEt | |
| 1-187 | CH ₂ Cl | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr | |
| 1-188 | CH ₂ Cl | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr-i | |
| 1-189 | CH ₂ Cl | 6-CH ₂ OMe | H | NEMe | |
| 1-190 | CH ₂ CN | H | H | N (Et) ₂ | |
| 1-191 | CH ₂ CN | H | H | N (Pr) ₂ | |
| 1-192 | CH ₂ CN | H | H | N (Me) ₂ | |
| 1-193 | CH ₂ CN | H | H | NHEt | |
| 1-194 | CH ₂ CN | H | H | NHPr | |
| 1-195 | CH ₂ CN | H | H | NHPr-i | |
| 1-196 | CH ₂ CN | H | H | NEMe | |
| 1-197 | CH ₂ CN | 3-F | H | N (Et) ₂ | |
| 1-198 | CH ₂ CN | 3-F | H | N (Pr) ₂ | |
| 1-199 | CH ₂ CN | 3-F | H | N (Me) ₂ | |
| 1-200 | CH ₂ CN | 3-F | H | NHEt | |
| 1-201 | CH ₂ CN | 3-F | H | NHPr | |
| 1-202 | CH ₂ CN | 3-F | H | NHPr-i | |
| 1-203 | CH ₂ CN | 3-F | H | NEMe | |
| 1-204 | CH ₂ CN | 5-F | H | N (Et) ₂ | |
| 1-205 | CH ₂ CN | 5-F | H | N (Pr) ₂ | |
| 1-206 | CH ₂ CN | 5-F | H | N (Me) ₂ | |
| 1-207 | CH ₂ CN | 5-F | H | NHEt | |
| 1-208 | CH ₂ CN | 5-F | H | NHPr | |
| 1-209 | CH ₂ CN | 5-F | H | NHPr-i | |
| 1-210 | CH ₂ CN | 5-F | H | NEMe | |
| 1-211 | CH ₂ CN | 6-Et | H | N (Et) ₂ | |
| 1-212 | CH ₂ CN | 6-Et | H | N (Pr) ₂ | |
| 1-213 | CH ₂ CN | 6-Et | H | N (Me) ₂ | |
| 1-214 | CH ₂ CN | 6-Et | H | NHEt | |


【0038】

【表8】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 比旋光度 (c _D ²⁰) |
|------------|--------------------|----------------|----------------|--------------------|--|
| I-215 | CH ₂ CN | 6-Et | H | NHPr | |
| I-216 | CH ₂ CN | 6-Et | H | NHPr-i | |
| I-217 | CH ₂ CN | 6-St | H | NHMe | |
| I-218 | CH ₂ CN | 6-F | H | N(Bz) ₂ | |
| I-219 | CH ₂ CN | 6-F | H | N(Pr) ₂ | |
| I-220 | CH ₂ CN | 6-F | H | N(Me) ₂ | |
| I-221 | CH ₂ CN | 6-F | H | NHSt | |
| I-222 | CH ₂ CN | 6-F | H | NHPr | |
| I-223 | CH ₂ CN | 6-F | H | NHPr-i | |
| I-224 | CH ₂ CN | 6-F | H | NHMe | |
| I-225 | CH ₂ CN | 6-Me | H | N(Bz) ₂ | |
| I-226 | CH ₂ CN | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | |
| I-227 | CH ₂ CN | 6-Me | H | N(Me) ₂ | |
| I-228 | CH ₂ CN | 6-Me | H | NHSt | |
| I-229 | CH ₂ CN | 6-Me | H | NHPr | |
| I-230 | CH ₂ CN | 6-Me | H | NHPr-i | |
| I-231 | CH ₂ CN | 6-Me | H | NHMe | |
| I-232 | CH ₂ CN | 6-OMe | H | N(Bz) ₂ | |
| I-233 | CH ₂ CN | 6-OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| I-234 | CH ₂ CN | 6-OMe | H | N(Me) ₂ | |
| I-235 | CH ₂ CN | 6-OMe | H | NHSt | |
| I-236 | CH ₂ CN | 6-OMe | H | NHPr | |
| I-237 | CH ₂ CN | 6-OMe | H | NHPr-i | |
| I-238 | CH ₂ CN | 6-OMe | H | NHMe | |
| I-239 | CH ₂ CN | 6-Pr | H | N(Bz) ₂ | |
| I-240 | CH ₂ CN | 6-Pr | H | N(Pr) ₂ | |
| I-241 | CH ₂ CN | 6-Pr | H | N(Me) ₂ | |
| I-242 | CH ₂ CN | 6-Pr | H | NHSt | |
| I-243 | CH ₂ CN | 6-Pr | H | NHPr | |
| I-244 | CH ₂ CN | 6-Pr | H | NHPr-i | |
| I-245 | CH ₂ CN | 6-Pr | H | NHMe | |






【0039】

【表9】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 結晶析 出率(%) (20°) |
|------------|---------------------------------|-----------------------|---------------------|---|----------------------------------|
| I-245 | CH ₂ CH ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Et) ₂ | 108-110 |
| I-247 | CH ₂ CH ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| I-248 | CH ₂ CH ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | |
| I-249 | CH ₂ CH ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | NHEt | |
| I-250 | CH ₂ CH ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr | |
| I-251 | CH ₂ CH ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr-i | |
| I-252 | CH ₂ CH ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | NHMe | |
| I-253 | CHF ₂ | H | H | N(Et) ₂ | |
| I-254 | CHF ₂ | H | Me | N(Et) ₂ | |
| I-255 | CHF ₂ | H | Bu | N(Et) ₂ | |
| I-256 | CHF ₂ | H | CH ₂ OMe | N(Et) ₂ | 67-69 |
| I-257 | CHF ₂ | H | H | N(Et)Pr | 91-92 |
| I-258 | CHF ₂ | H | H | N(Et)Bu | 88-90 |
| I-259 | CHF ₂ | H | H | N(Pr) ₂ | 104-105 |
| I-260 | CHF ₂ | H | H | N(Pr-1) ₂ | 41-43 |
| I-261 | CHF ₂ | H | H | N(Bu) ₂ | 79-81 |
| I-262 | CHF ₂ | H | H | N(Bu-1) ₂ | 117-119 |
| I-263 | CHF ₂ | H | H | N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ NO) ₂ | 94-95 |
| I-264 | CHF ₂ | H | H | N(CH ₂ CH ₂ CHO) ₂ | 125-126 |
| I-265 | CHF ₂ | H | H | N(Me) ₂ | 152-154 |
| I-266 | CHF ₂ | H | H | N(Me)Et | 1.5382 |
| I-267 | CHF ₂ | H | H | N(Me)Pr | 1.5341 |
| I-268 | CHF ₂ | H | H | N(Me)Bu | 109-110 |
| I-269 | CHF ₂ | H | H | NHEt | 188-190 |
| I-270 | CHF ₂ | H | H | NHPr-o | 126-128 |
| I-271 | CHF ₂ | H | H | NHPr | 166-167 |
| I-272 | CHF ₂ | H | H | NHPr-i | 134-136 |
| I-273 | CHF ₂ | H | H | NHBu | 152-153 |
| I-274 | CHF ₂ | H | H | NHBu-i | 125-126 |
| I-275 | CHF ₂ | H | H | NHBu-t | 39-40 |
| I-276 | CHF ₂ | H | H | NHPh | 91-93 |
| I-277 | CHF ₂ | H | H | NH-  | 109-111 |

【0040】

【表10】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) ±5 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|------------------|----------------|----------------|---|---|
| 1-278 | CHF ₂ | H | H | NHC ₆ H ₁₃ | 76-78 |
| 1-279 | CHF ₂ | H | H | NHC ₂ CF ₂ CF ₃ | 1.4944 |
| 1-280 | CHF ₂ | H | H | NHC ₂ CF ₃ | 1.5000 |
| 1-281 | CHF ₂ | H | H | NHC ₂ CH=CH ₂ | 137-138 |
| 1-282 | CHF ₂ | H | H | NHC ₂ C=CH | 87-88 |
| 1-283 | CHF ₂ | H | H | NHC ₂ CH ₂ OMe | 122-123 |
| 1-284 | CHF ₂ | H | H | NHn | 106-106 |
| 1-285 | CHF ₂ | H | H | NHMe | 174-175 |
| 1-286 | CHF ₂ | H | H | NNHCOMe | 74-76 |
| 1-287 | CHF ₂ | H | H | NNHCOPh | 82-84 |
| 1-288 | CHF ₂ | H | H | NNNMe | 1.5385 |
| 1-289 | CHF ₂ | H | H | NN(OMe) ₂ | 145-146 |
| 1-290 | CHF ₂ | H | H | NHPh | 145-146 |
| 1-291 | CHF ₂ | H | H | NHPh(2-OMe) | 126-129 |
| 1-292 | CHF ₂ | H | H | NHPh(3-OMe) | 155-168 |
| 1-293 | CHF ₂ | H | H | NHPh(4-OMe) | 1.5452 |
| 1-294 | CHF ₂ | H | H |  | 1.5306 |
| 1-295 | CHF ₂ | H | H |  | 1.5342 |
| 1-296 | CHF ₂ | H | H |  | 143-144 |
| 1-297 | CHF ₂ | 3-F | H |  | 174-175 |
| 1-298 | CHF ₂ | 3-F | H | N(Et) ₂ | 119-120 |
| 1-299 | CHF ₂ | 3-F | H | NHPr | 111-112 |
| 1-300 | CHF ₂ | 3-F | H | NHPr-1 | 143-145 |
| 1-301 | CHF ₂ | 5-F | H |  | 1.5232 |
| 1-302 | CHF ₂ | 5-F | H | N(Et) ₂ | 113-114 |



【0041】

【表11】

| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融点(°C) 比旋光度 (c _D ²⁰) |
|-----------|------------------|----------------|----------------|---|---|
| 1-303 | CHF ₂ | 5-F | H | N(Fr) ₂ | 124-125 |
| 1-304 | CHF ₂ | 5-F | H | N(Fr-1) ₂ | 137-139 |
| 1-305 | CHF ₂ | 5-F | H | N(Bu) ₂ | 113-114 |
| 1-306 | CHF ₂ | 5-F | H | N(Bu-1) ₂ | 147-148 |
| 1-307 | CHF ₂ | 5-F | H | N(Bu-a) ₂ | 137-138 |
| 1-308 | CHF ₂ | 5-F | H | N(CH ₂ CH ₂ OO) ₂ | 123-129 |
| 1-309 | CHF ₂ | 5-F | H | N(Me) ₂ | 82-83 |
| 1-310 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr | 195-197 |
| 1-311 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-1 | 178-179 |
| 1-312 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-1 | 180-181 |
| 1-313 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-a | 192-193 |
| 1-314 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-a-1 | 149-151 |
| 1-315 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-a-s | 143-145 |
| 1-316 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-a-t | 48-50 |
| 1-317 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-CH ₂ -C≡CH | 140-141 |
| 1-318 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-1-c | 154-155 |
| 1-319 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-CH ₂ -CF ₃ | 1.4994 |
| 1-320 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ | 167-169 |
| 1-321 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-CH ₂ -CH ₂ -OMe | 113-114 |
| 1-322 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-a | 139-139 |
| 1-323 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-a | 208-210 |
| 1-324 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-OMe | 121-123 |
| 1-325 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-OMe | 158-169 |
| 1-326 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-CH ₂ -Et | 122-124 |
| 1-327 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-Ph | 138-137 |
| 1-328 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-(Me) ₂ | 130-131 |
| 1-329 | CHF ₂ | 5-F | H | NBr-Ph | 143-150 |
| 1-330 | CHF ₂ | 6-Et | H | N(Et) ₂ | 129-130 |
| 1-331 | CHF ₂ | 6-Et | H | N(Bu) ₂ | 115-117 |
| 1-332 | CHF ₂ | 6-Et | H | N(Me) ₂ | 143-150 |
| 1-333 | CHF ₂ | 6-Et | H | NBr-1 | 232-235 |
| 1-334 | CHF ₂ | 6-Et | H | NBr-1 | 194-195 |

【0042】

【表12】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 及 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-----------------|-----------------------|----------------|--|---|
| 1-335 | CH ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | N(Et) ₂ | 142-143 |
| 1-336 | CH ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHPr | 162-163 |
| 1-337 | CH ₂ | 6-F | H | N(Et) ₂ | 58-59 |
| 1-338 | CH ₂ | 6-F | H | N(Pr) ₂ | 128-129 |
| 1-339 | CH ₂ | 6-F | H | N(Me) ₂ | 192-193 |
| 1-340 | CH ₂ | 6-F | H | NHEt | 187-188 |
| 1-341 | CH ₂ | 6-F | H | NH ₂ Pr | 159-160 |
| 1-342 | CH ₂ | 6-F | H | NHMe | 209-210 |
| 1-343 | CH ₂ | 6-Me | H | N(Et) ₂ | 118-120 |
| 1-344 | CH ₂ | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | 133-134 |
| 1-345 | CH ₂ | 6-Me | H | NHEt | 204-205 |
| 1-346 | CH ₂ | 6-Me | H | NHPr | 185-186 |
| 1-347 | CH ₂ | 6-OMe | H | N(Et) ₂ | 93-94 |
| 1-348 | CH ₂ | 6-OMe | H | N(Et)Bu | 測定不可 |
| 1-349 | CH ₂ | 6-OMe | H | N(Me) ₂ | 118-119 |
| 1-350 | CH ₂ | 6-OMe | H | NHEt | 209-210 |
| 1-351 | CH ₂ | 6-OMe | H | NH ₂ Pr | 132-133 |
| 1-352 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H |  | 測定不可 |
| 1-353 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Et) ₂ | 124-125 |
| 1-354 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Et)Bu | 78-80 |
| 1-355 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Pr) ₂ | 123-124 |
| 1-356 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Pr-1) ₂ | 68-70 |
| 1-357 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | 89-90 |
| 1-358 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | 159-160 |
| 1-359 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHEt | 188-189 |
| 1-360 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr | 189-190 |
| 1-361 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr-1 | 197-198 |
| 1-362 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NH ₂ Pr | 175-176 |
| 1-363 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr ₂ | 173-174 |
| 1-364 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NH  | 195-197 |

【0043】

【表13】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 及 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-------------------|----------------------|----------------|--------------------|--|
| 1-365 | CHF ₂ | 6-CH ₃ Me | H | NiMe | 108-200 |
| 1-366 | CHF ₂ | 6-Pr | H | N(Et) ₂ | 123-125 |
| 1-367 | CHF ₂ | 6-Pr | H | N(Pr) ₂ | 133-141 |
| 1-368 | CHF ₂ | 6-Pr | H | N(Me) ₂ | 155-166 |
| 1-369 | CHF ₂ | 6-Pr | H | NHEt | 210-211 |
| 1-370 | CHF ₂ | 6-Pr | H | NHPr | 199-200 |
| 1-371 | CHF ₂ | 6-Pr | H | NHPr-i | 158-158 |
| 1-372 | CHF ₂ | 6-Pr | H | NHMe | 180-181 |
| 1-373 | CHCl ₂ | H | H | N(Et) ₂ | |
| 1-374 | CHCl ₂ | H | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-375 | CHCl ₂ | H | H | N(Me) ₂ | |
| 1-376 | CHCl ₂ | H | H | NHEt | |
| 1-377 | CHCl ₂ | H | H | NHPr | |
| 1-378 | CHCl ₂ | H | H | NHPr-i | |
| 1-379 | CHCl ₂ | H | H | NiMe | |
| 1-380 | CHCl ₂ | 3-F | H | N(Et) ₂ | |
| 1-381 | CHCl ₂ | 3-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-382 | CHCl ₂ | 3-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-383 | CHCl ₂ | 3-F | H | NHEt | |
| 1-384 | CHCl ₂ | 3-F | H | NHPr | |
| 1-385 | CHCl ₂ | 3-F | H | NHPr-i | |
| 1-386 | CHCl ₂ | 3-F | H | NiMe | |
| 1-387 | CHCl ₂ | 5-F | H | N(Et) ₂ | |
| 1-388 | CHCl ₂ | 5-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-389 | CHCl ₂ | 5-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-390 | CHCl ₂ | 5-F | H | NHEt | |
| 1-391 | CHCl ₂ | 5-F | H | NHPr | |
| 1-392 | CHCl ₂ | 5-F | H | NHPr-i | |
| 1-393 | CHCl ₂ | 5-F | H | NiMe | |
| 1-394 | CHCl ₂ | 6-F | H | N(Et) ₂ | |
| 1-395 | CHCl ₂ | 6-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-396 | CHCl ₂ | 6-F | H | N(Me) ₂ | |

【0044】

【表14】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 比 重 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-------------------|-----------------------|----------------|--------------------|---|
| 1-397 | CHCl ₂ | 6-F | H | NHEt | |
| 1-398 | CHCl ₂ | 6-F | H | NHPr | |
| 1-399 | CHCl ₂ | 6-F | H | NHPr-i | |
| 1-400 | CHCl ₂ | 6-F | H | NHMe | |
| 1-401 | CHCl ₂ | 6-Bt | H | N(Et) ₂ | |
| 1-402 | CHCl ₂ | 6-Bt | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-403 | CHCl ₂ | 6-Bt | H | N(Me) ₂ | |
| 1-404 | CHCl ₂ | 6-Bt | H | NHEt | |
| 1-405 | CHCl ₂ | 6-Bt | H | NHPr | |
| 1-406 | CHCl ₂ | 6-Bt | H | NHPr-i | |
| 1-407 | CHCl ₂ | 6-Bt | H | NHMe | |
| 1-408 | CHCl ₂ | 6-Me | H | N(Et) ₂ | |
| 1-409 | CHCl ₂ | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-410 | CHCl ₂ | 6-Me | H | N(Me) ₂ | |
| 1-411 | CHCl ₂ | 6-Me | H | NHEt | |
| 1-412 | CHCl ₂ | 6-Me | H | NHPr | |
| 1-413 | CHCl ₂ | 6-Me | H | NHPr-i | |
| 1-414 | CHCl ₂ | 6-Me | H | NHMe | |
| 1-415 | CHCl ₂ | 6-OMe | H | N(Et) ₂ | |
| 1-416 | CHCl ₂ | 6-OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-417 | CHCl ₂ | 6-OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 1-418 | CHCl ₂ | 6-OMe | H | NHEt | |
| 1-419 | CHCl ₂ | 6-OMe | H | NHPr | |
| 1-420 | CHCl ₂ | 6-OMe | H | NHPr-i | |
| 1-421 | CHCl ₂ | 6-OMe | H | NHMe | |
| 1-422 | CHCl ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Et) ₂ | |
| 1-423 | CHCl ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-424 | CHCl ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 1-425 | CHCl ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHEt | |
| 1-426 | CHCl ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr | |
| 1-427 | CHCl ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr-i | |
| 1-428 | CHCl ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHMe | |

【0045】

【表15】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 及 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-------------------|----------------|----------------|--------------------|---|
| 1-429 | CHCl ₂ | 6-Pr | H | N(Bt) ₂ | |
| 1-430 | CHCl ₂ | 6-Pr | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-431 | CHCl ₂ | 6-Pr | H | N(Me) ₂ | |
| 1-432 | CHCl ₂ | 6-Pr | H | NBt | |
| 1-433 | CHCl ₂ | 6-Pr | H | NHPr | |
| 1-434 | CHCl ₂ | 6-Pr | H | NHPr-1 | |
| 1-435 | CHCl ₂ | 6-Pr | H | NMe | |
| 1-436 | CF ₃ | 3-F | H | N(Bt) ₂ | |
| 1-437 | CF ₃ | 3-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-438 | CF ₃ | 3-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-439 | CF ₃ | 3-F | H | NBt | |
| 1-440 | CF ₃ | 3-F | H | NHPr | |
| 1-441 | CF ₃ | 3-F | H | NHPr-1 | |
| 1-442 | CF ₃ | 3-F | H | NMe | |
| 1-443 | CF ₃ | 5-F | H | N(Bt) ₂ | |
| 1-444 | CF ₃ | 5-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-445 | CF ₃ | 5-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-446 | CF ₃ | 5-F | H | NBt | |
| 1-447 | CF ₃ | 5-F | H | NHPr | |
| 1-448 | CF ₃ | 5-F | H | NHPr-1 | |
| 1-449 | CF ₃ | 5-F | H | NMe | |
| 1-450 | CF ₃ | 6-F | H | N(Bt) ₂ | |
| 1-451 | CF ₃ | 6-F | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-452 | CF ₃ | 6-F | H | N(Me) ₂ | |
| 1-453 | CF ₃ | 6-F | H | NBt | |
| 1-454 | CF ₃ | 6-F | H | NHPr | |
| 1-455 | CF ₃ | 6-F | H | NHPr-1 | |
| 1-456 | CF ₃ | 6-F | H | NMe | |
| 1-457 | CF ₃ | 6-Me | H | N(Bt) ₂ | |
| 1-458 | CF ₃ | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-459 | CF ₃ | 6-Me | H | N(Me) ₂ | |
| 1-460 | CF ₃ | 6-Me | H | NBt | |






【0046】

【表16】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 比 重 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-----------------|-----------------------|----------------|--------------------|---|
| 1-451 | CF ₃ | 6-Me | H | NHPr | |
| 1-452 | CF ₃ | 6-Me | H | NHPr-i | |
| 1-453 | CF ₃ | 6-Me | H | NHMe | |
| 1-454 | CF ₃ | 6-Et | H | N(Et) ₂ | |
| 1-455 | CF ₃ | 6-Et | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-456 | CF ₃ | 6-Et | H | N(Me) ₂ | |
| 1-457 | CF ₃ | 6-Et | H | NHEt | |
| 1-458 | CF ₃ | 6-Et | H | NHPr | |
| 1-459 | CF ₃ | 6-Et | H | NHPr-i | |
| 1-470 | CF ₃ | 6-Et | H | NHMe | |
| 1-471 | CF ₃ | 6-Pr | H | N(Et) ₂ | |
| 1-472 | CF ₃ | 6-Pr | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-473 | CF ₃ | 6-Pr | H | N(Me) ₂ | |
| 1-474 | CF ₃ | 6-Pr | H | NHEt | |
| 1-475 | CF ₃ | 6-Pr | H | NHPr | |
| 1-476 | CF ₃ | 6-Pr | H | NHPr-i | |
| 1-477 | CF ₃ | 6-Pr | H | NHMe | |
| 1-478 | CF ₃ | 6-OMe | H | N(Et) ₂ | |
| 1-479 | CF ₃ | 6-OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-480 | CF ₃ | 6-OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 1-481 | CF ₃ | 6-OMe | H | NHEt | |
| 1-482 | CF ₃ | 6-OMe | H | NHPr | |
| 1-483 | CF ₃ | 6-OMe | H | NHPr-i | |
| 1-484 | CF ₃ | 6-OMe | H | NHMe | |
| 1-485 | CF ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Et) ₂ | |
| 1-486 | CF ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-487 | CF ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 1-488 | CF ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | NHEt | |
| 1-489 | CF ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr | |
| 1-490 | CF ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr-i | |
| 1-491 | CF ₃ | 6-CH ₂ OMe | H | NHMe | |


【0047】

【表17】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 比 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-----------------|----------------|----------------|---|---|
| I-492 | CF ₃ | H | H | N(Ct) ₂ | 181-182 |
| I-493 | CF ₃ | H | H | N(Ct)Pr | 208-210 |
| I-494 | CF ₃ | H | H | N(Ct)Bu | 103-105 |
| I-495 | CF ₃ | H | H | N(Ct)Ph | 1.5428 |
| I-496 | CF ₃ | H | H | N(Pr) ₂ | 140-141 |
| I-497 | CF ₃ | H | H | N(Pr-i) ₂ | 175-176 |
| I-498 | CF ₃ | H | H | N(tBu) ₂ | 110-111 |
| I-499 | CF ₃ | H | H | N(tBu-i) ₂ | 158-159 |
| I-500 | CF ₃ | H | H | N(tBu-o) ₂ | 127-128 |
| I-501 | CF ₃ | H | H | N(Phen) ₂ | 1.5258 |
| I-502 | CF ₃ | H | H | N(C ₆ H ₁₃) ₂ | 1.5191 |
| I-503 | CF ₃ | H | H | N(CH ₂ C≡CH) ₂ | 1.5269 |
| I-504 | CF ₃ | H | H | N(CH ₂ CH=CH) ₂ | 1.5364 |
| I-505 | CF ₃ | H | H | N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂ | 140-141 |
| I-506 | CF ₃ | H | H | N(Me) ₂ | 200-201 |
| I-507 | CF ₃ | H | H | N(Me)Et | 119-121 |
| I-508 | CF ₃ | H | H |  | 171-173 |
| I-509 | CF ₃ | H | H |  | 76- 78 |
| I-510 | CF ₃ | H | H |  | 96- 97 |
| I-511 | CF ₃ | H | H |  | 165-166 |
| I-512 | CF ₃ | H | H |  | 198-199 |
| I-513 | CF ₃ | H | H | N(Me)Pr | 132-135 |
| I-514 | CF ₃ | H | H | N(Me)Bu | 181-182 |
| I-515 | CF ₃ | H | H | N(Me)COMe | 159-160 |
| I-516 | CF ₃ | H | H | N(Me)Ph | 1.5461 |
| I-517 | CF ₃ | H | H | NH ₂ | 209-211 |

【0048】

【表18】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 比 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-----------------|----------------|---------------------|---|--|
| 1-518 | CF ₃ | H | Me | NH ₂ | |
| 1-519 | CF ₃ | H | Bn | NH ₂ | |
| 1-520 | CF ₃ | H | CH ₂ OMe | NH ₂ | |
| 1-521 | CF ₃ | H | H | NHC(Me) ₂ Cl | 211-212 |
| 1-522 | CF ₃ | H | H | NHt | 218-220 |
| 1-523 | CF ₃ | H | H | NHPr-c | 172-173 |
| 1-524 | CF ₃ | H | H | NHPr | 215-216 |
| 1-525 | CF ₃ | H | H | NHPr-i | 188-189 |
| 1-526 | CF ₃ | H | H | NHn-c | 148-149 |
| 1-527 | CF ₃ | H | H | NHn | 204-205 |
| 1-528 | CF ₃ | H | H | NHn-i | 136-137 |
| 1-529 | CF ₃ | H | H | NHn-s | 174-175 |
| 1-530 | CF ₃ | H | H | NHn-t | 125-127 |
| 1-531 | CF ₃ | H | H | NHPh | 154-155 |
| 1-532 | CF ₃ | H | H | NHPh-c | 143-145 |
| 1-533 | CF ₃ | H | H | NH-  | 151-153 |
| 1-534 | CF ₃ | H | H | NHC ₆ H ₁₃ | 125-127 |
| 1-535 | CF ₃ | H | H | NHC ₆ H ₁₇ | 145-146 |
| 1-536 | CF ₃ | H | H | NHC(Et) ₂ | 183-185 |
| 1-537 | CF ₃ | H | H | NHC(OMe)Ph | 156-158 |
| 1-538 | CF ₃ | H | H | NHC ₂ C=Cl | 144-145 |
| 1-539 | CF ₃ | H | H | NHC ₂ CF ₃ | 1.4947 |
| 1-540 | CF ₃ | H | H | NHC ₂ CH=CH ₂ | 182-184 |
| 1-541 | CF ₃ | H | H | NHC ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | 177-179 |
| 1-542 | CF ₃ | H | H | NHC ₂ CH ₂ OMe | 183-185 |
| 1-543 | CF ₃ | H | H | NHn | 166-168 |
| 1-544 | CF ₃ | H | H | NHMe | 179-181 |
| 1-545 | CF ₃ | H | H | NHCHO | 155-157 |
| 1-546 | CF ₃ | H | H | NHCOMe | 177-178 |
| 1-547 | CF ₃ | H | H | NHCONHt | 157-158 |
| 1-548 | CF ₃ | H | H | NHCON(OMe) ₂ | 170-172 |
| 1-549 | CF ₃ | H | H | NHCOMe | 148-150 |

【0049】

【表19】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 比 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|--------------------------------|-------------------------|----------------|--------------------------------------|--|
| I-550 | CF ₃ | H | H | NHCSNMe | 76-78 |
| I-551 | CF ₃ | H | H | NHRCOMe | 147-149 |
| I-552 | CF ₃ | H | H | NHRCOOEt | 125-126 |
| I-553 | CF ₃ | H | H | NHRCMe | 183-185 |
| I-554 | CF ₃ | H | H | NHRCPh | 154-155 |
| I-555 | CF ₃ | H | H | NHPh | 139-140 |
| I-556 | CF ₃ | H | H | NHPh (2-Cl) | 152-153 |
| I-557 | CF ₃ | H | H | NHPh (2-Me) | 155-156 |
| I-558 | CF ₃ | H | H | NHPh (2-OMe) | 120-121 |
| I-559 | CF ₃ | H | H | NHPh (3-Cl) | 157-158 |
| I-560 | CF ₃ | H | H | NHPh (3-Me) | 142-143 |
| I-561 | CF ₃ | H | H | NHPh (3-OMe) | 104-105 |
| I-562 | CF ₃ | H | H | NHPh (4-Cl) | 159-161 |
| I-563 | CF ₃ | H | H | NHPh (4-Me) | 158-170 |
| I-564 | CF ₃ | H | H | NHPh (4-OMe) | 146-147 |
| I-565 | CF ₃ | H | H | NHSO ₂ CF ₃ | 180-187 |
| I-566 | CF ₃ | H | H | NHSO ₂ CH ₂ Cl | 118-120 |
| I-567 | CF ₃ | H | H | NHSO ₂ Me | 171-172 |
| I-568 | CF ₃ | H | H | N(Ph) ₂ | 145-146 |
| I-569 | CH ₂ F ₂ | 3, 4-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-570 | CH ₂ F ₂ | 3, 5-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-571 | CH ₂ F ₂ | 3, 6-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-572 | CH ₂ F ₂ | 4, 5-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-573 | CH ₂ F ₂ | 4, 6-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-574 | CH ₂ F ₂ | 5, 6-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-575 | CH ₂ F ₂ | 3, 4-Cl ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-576 | CH ₂ F ₂ | 3, 5-Cl ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-577 | CH ₂ F ₂ | 3, 6-Me ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-578 | CH ₂ F ₂ | 4, 5-Me ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-579 | CH ₂ F ₂ | 4, 6-(OMe) ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-580 | CH ₂ F ₂ | 5, 6-(OMe) ₂ | H | N(Et) ₂ | |

【0050】

【表20】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 比 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|-------------------------|----------------|--------------------|--|
| 1-581 | CH ₂ Br | 3, 4-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-582 | CH ₂ Br | 3, 5-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-583 | CH ₂ Br | 3, 6-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-584 | CH ₂ Br | 4, 5-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-585 | CH ₂ Br | 4, 6-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-586 | CH ₂ Br | 5, 6-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-587 | CH ₂ Br | 3, 4-Cl ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-588 | CH ₂ Br | 3, 5-Cl ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-589 | CH ₂ Br | 3, 6-Me ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-590 | CH ₂ Br | 4, 5-Me ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-591 | CH ₂ Br | 4, 6-(OMe) ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-592 | CH ₂ Br | 5, 6-(OMe) ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-593 | CH ₂ Cl | 3, 4-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-594 | CH ₂ Cl | 3, 5-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-595 | CH ₂ Cl | 3, 6-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-596 | CH ₂ Cl | 4, 5-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-597 | CH ₂ Cl | 4, 6-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-598 | CH ₂ Cl | 5, 6-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-599 | CH ₂ Cl | 3, 4-Cl ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-600 | CH ₂ Cl | 3, 5-Cl ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-601 | CH ₂ Cl | 3, 6-Me ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-602 | CH ₂ Cl | 4, 5-Me ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-603 | CH ₂ Cl | 4, 6-(OMe) ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-604 | CH ₂ Cl | 5, 6-(OMe) ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-605 | CH ₂ CN | 3, 4-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-606 | CH ₂ CN | 3, 5-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-607 | CH ₂ CN | 3, 6-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-608 | CH ₂ CN | 4, 5-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-609 | CH ₂ CN | 4, 6-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-610 | CH ₂ CN | 5, 6-F ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-611 | CH ₂ CN | 3, 4-Cl ₂ | H | N(Ct) ₂ | |
| 1-612 | CH ₂ CN | 3, 5-Cl ₂ | H | N(Ct) ₂ | |

【0051】

【表21】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 結晶 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|-------------------------|----------------|----------------------------------|---|
| I-813 | CH ₂ CH | 3, 6-Me ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-814 | CH ₂ CH | 4, 5-Me ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-815 | CH ₂ CH | 4, 6-(OMe) ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-816 | CH ₂ CH | 5, 6-(OMe) ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-817 | CHF ₂ | 3, 4-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-818 | CHF ₂ | 3, 5-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-819 | CHF ₂ | 3, 6-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-820 | CHF ₂ | 4, 5-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-821 | CHF ₂ | 4, 6-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-822 | CHF ₂ | 5, 6-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-823 | CHF ₂ | 3, 4-Cl ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-824 | CHF ₂ | 3, 5-Cl ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-825 | CHF ₂ | 3, 6-Me ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-826 | CHF ₂ | 4, 5-Me ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-827 | CHF ₂ | 4, 6-(OMe) ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-828 | CHF ₂ | 5, 6-(OMe) ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-829 | CHCl ₂ | 3, 4-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-830 | CHCl ₂ | 3, 5-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-831 | CHCl ₂ | 3, 6-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-832 | CHCl ₂ | 4, 5-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-833 | CHCl ₂ | 4, 6-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-834 | CHCl ₂ | 5, 6-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-835 | CHCl ₂ | 3, 4-Cl ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-836 | CHCl ₂ | 3, 5-Cl ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-837 | CHCl ₂ | 3, 6-Me ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-838 | CHCl ₂ | 4, 5-Me ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-839 | CHCl ₂ | 4, 6-(OMe) ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-840 | CHCl ₂ | 5, 6-(OMe) ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-841 | CF ₃ | 3, 4-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-842 | CF ₃ | 3, 5-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-843 | CF ₃ | 3, 6-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |
| I-844 | CF ₃ | 4, 5-F ₂ | H | N(CH ₃) ₂ | |

【0052】

【表22】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 比々 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-------------------------|-------------------------|----------------|---------------------|---|
| I-645 | CF ₃ | 4, 6-F ₂ | H | N (3t) ₂ | |
| I-646 | CF ₃ | 5, 6-F ₂ | H | N (3t) ₂ | |
| I-647 | CF ₃ | 3, 4-Cl ₂ | H | N (3t) ₂ | |
| I-648 | CF ₃ | 3, 5-Cl ₂ | H | N (3t) ₂ | |
| I-649 | CF ₃ | 3, 6-Me ₂ | H | N (3t) ₂ | |
| I-650 | CF ₃ | 4, 5-Me ₂ | H | N (3t) ₂ | |
| I-651 | CF ₃ | 4, 6-(OMe) ₂ | H | N (3t) ₂ | |
| I-652 | CF ₃ | 5, 6-(OMe) ₂ | H | N (3t) ₂ | |
| I-653 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | N (3t) ₂ | |
| I-654 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | N (3t) ₂ | |
| I-655 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | N (3t) ₂ | |
| I-656 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | NHSt | |
| I-657 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | NHPr | |
| I-658 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | NHPr-i | |
| I-659 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | NHMe | |
| I-660 | CH ₂ CH=CHCl | 3-F | H | N (3t) ₂ | |
| I-661 | CH ₂ CH=CHCl | 3-F | H | N (3t) ₂ | |
| I-662 | CH ₂ CH=CHCl | 3-F | H | N (3t) ₂ | |
| I-663 | CH ₂ CH=CHCl | 3-F | H | NHSt | |
| I-664 | CH ₂ CH=CHCl | 3-F | H | NHPr | |
| I-665 | CH ₂ CH=CHCl | 3-F | H | NHPr-i | |
| I-666 | CH ₂ CH=CHCl | 3-F | H | NHMe | |
| I-667 | CH ₂ CH=CHCl | 5-F | H | N (3t) ₂ | |
| I-668 | CH ₂ CH=CHCl | 5-F | H | N (3t) ₂ | |
| I-669 | CH ₂ CH=CHCl | 5-F | H | N (3t) ₂ | |
| I-670 | CH ₂ CH=CHCl | 5-F | H | NHSt | |
| I-671 | CH ₂ CH=CHCl | 5-F | H | NHPr | |
| I-672 | CH ₂ CH=CHCl | 5-F | H | NHPr-i | |
| I-673 | CH ₂ CH=CHCl | 5-F | H | NHMe | |
| I-674 | CH ₂ CH=CHCl | 6-F | H | N (3t) ₂ | |
| I-675 | CH ₂ CH=CHCl | 6-F | H | N (3t) ₂ | |
| I-676 | CH ₂ CH=CHCl | 6-F | H | N (3t) ₂ | |

【0053】







【表23】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 比 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-------------------------|----------------|----------------|--------------------|--|
| 1-677 | CH ₂ CH=CHCl | 6-F | H | NHEt | |
| 1-678 | CH ₂ CH=CHCl | 6-F | H | NHPr | |
| 1-679 | CH ₂ CH=CHCl | 6-F | H | NHPr-i | |
| 1-680 | CH ₂ CH=CHCl | 6-F | H | NMe | |
| 1-681 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Me | H | N(Et) ₂ | |
| 1-682 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Me | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-683 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Me | H | N(Me) ₂ | |
| 1-684 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Me | H | NHEt | |
| 1-685 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Me | H | NHPr | |
| 1-686 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Me | H | NHPr-i | |
| 1-687 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Me | H | NMe | |
| 1-688 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Et | H | N(Et) ₂ | |
| 1-689 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Et | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-690 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Et | H | N(Me) ₂ | |
| 1-691 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Et | H | NHEt | |
| 1-692 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Et | H | NHPr | |
| 1-693 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Et | H | NHPr-i | |
| 1-694 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Et | H | NMe | |
| 1-695 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Pr | H | N(Et) ₂ | |
| 1-696 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Pr | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-697 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Pr | H | N(Me) ₂ | |
| 1-698 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Pr | H | NHEt | |
| 1-699 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Pr | H | NHPr | |
| 1-700 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Pr | H | NHPr-i | |
| 1-701 | CH ₂ CH=CHCl | 6-Pr | H | NMe | |
| 1-702 | CH ₂ CH=CHCl | 6-OMe | H | N(Et) ₂ | |
| 1-703 | CH ₂ CH=CHCl | 6-OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| 1-704 | CH ₂ CH=CHCl | 6-OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 1-705 | CH ₂ CH=CHCl | 6-OMe | H | NHEt | |
| 1-706 | CH ₂ CH=CHCl | 6-OMe | H | NHPr | |
| 1-707 | CH ₂ CH=CHCl | 6-OMe | H | NHPr-i | |
| 1-708 | CH ₂ CH=CHCl | 6-OMe | H | NMe | |

【0054】


【表24】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 比重量折 率(n _D ²⁰) |
|------------|-------------------------|------------------------|----------------|--|--|
| I-709 | CH ₂ CH=CHCl | 6-CH ₂ OMe | H | N(Et) ₂ | 123-124 |
| I-710 | CH ₂ CH=CHCl | 6-CH ₂ OMe | H | N(Pr) ₂ | |
| I-711 | CH ₂ CH=CHCl | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | |
| I-712 | CH ₂ CH=CHCl | 6-CH ₂ OMe | H | NHEt | |
| I-713 | CH ₂ CH=CHCl | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr | |
| I-714 | CH ₂ CH=CHCl | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr-i | |
| I-715 | CH ₂ CH=CHCl | 6-CH ₂ OMe | H | NMe | |
| I-716 | CH ₂ CH=CHCl | 3,4-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-717 | CH ₂ CH=CHCl | 3,6-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-718 | CH ₂ CH=CHCl | 3,6-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-719 | CH ₂ CH=CHCl | 4,5-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-720 | CH ₂ CH=CHCl | 4,6-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-721 | CH ₂ CH=CHCl | 5,6-F ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-722 | CH ₂ CH=CHCl | 3,4-Cl ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-723 | CH ₂ CH=CHCl | 3,5-Cl ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-724 | CH ₂ CH=CHCl | 3,6-Me ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-725 | CH ₂ CH=CHCl | 4,5-Me ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-726 | CH ₂ CH=CHCl | 4,6-(OMe) ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-727 | CH ₂ CH=CHCl | 5,6-(OMe) ₂ | H | N(Et) ₂ | |
| I-728 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Me) ₂ | |
| I-729 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Et)Pr | |
| I-730 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Et)Bu | |
| I-731 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Pr) ₂ | |
| I-732 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Pr-i) ₂ | |
| I-733 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Bal) ₂ | |
| I-734 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Bu-i) ₂ | |
| I-735 | CEP ₂ | 3-F | H | N(CH ₂ CH ₂ CO) ₂ | |
| I-736 | CEP ₂ | 3-F | H | N(CH ₂ CH ₂ CO) ₂ | |
| I-737 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Me)Et | |
| I-738 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Me)Pr | |
| I-739 | CEP ₂ | 3-F | H | N(Me)Bu | |
| I-740 | CEP ₂ | 3-F | H | NMe | 199-200 |

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 折光率(n _D ²⁰) |
|------------|------------------|----------------|----------------|--|--|
| I-741 | CEP ₂ | 3-F | H | NHEt | 169-170 |
| I-742 | CEP ₂ | 3-F | H | NHPr-c | |
| I-743 | CEP ₂ | 3-F | H | NHBu | |
| I-744 | CEP ₂ | 3-F | H | NHBu-1 | |
| I-745 | CEP ₂ | 3-F | H | NHBu-t | |
| I-746 | CEP ₂ | 3-F | H | NHPen | |
| I-747 | CEP ₂ | 3-F | H | NH  | |
| I-748 | CEP ₂ | 3-F | H | NHCH ₂ ¹³ | |
| I-749 | CEP ₂ | 3-F | H | NHCH ₂ CH ₂ CH ₃ | |
| I-750 | CEP ₂ | 3-F | H | NHCH ₂ CH ₃ | |
| I-751 | CEP ₂ | 3-F | H | NHCH ₂ CH=CH ₂ | 120-130 |
| I-752 | CEP ₂ | 3-F | H | NHCH ₂ C≡CH | |
| I-753 | CEP ₂ | 3-F | H | NHCH ₂ CH ₂ OMe | |
| I-754 | CEP ₂ | 3-F | H | NHCH ₂ Ph | |
| I-755 | CEP ₂ | 3-F | H | NNHCOMe | |
| I-756 | CEP ₂ | 3-F | H | NNHCOPh | |
| I-757 | CEP ₂ | 3-F | H | NNHOMe | 1.5410 |
| I-758 | CEP ₂ | 3-F | H | NNH(OMe) ₂ | 120-131 |
| I-759 | CEP ₂ | 3-F | H | NHPh | |
| I-760 | CEP ₂ | 3-F | H | NHPh(2-OMe) | |
| I-761 | CEP ₂ | 3-F | H | NHPh(3-OMe) | |
| I-762 | CEP ₂ | 3-F | H | NHPh(4-OMe) | |
| I-763 | CEP ₂ | 3-F | H | -N  | |
| I-764 | CEP ₂ | 3-F | H | -N  -Me | |
| I-765 | CEP ₂ | 6-Bt | H | -N  | |
| I-766 | CEP ₂ | 6-Bt | H | -N  -Me | |
| I-767 | CEP ₂ | 6-Bt | H | -N  | |





【0056】

【表26】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 比重量折 率(n _D ²⁰) |
|------------|------------------|----------------|----------------|---|---|
| I-766 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(Rt)Pr | |
| I-769 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(Rt)Bu | |
| I-770 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(Pr) ₂ | |
| I-771 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(Pr-i) ₂ | |
| I-772 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(Bu-i) ₂ | |
| I-773 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ | |
| I-774 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂ | |
| I-775 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(Me)Et | |
| I-776 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(Me)Pr | |
| I-777 | CEP ₂ | 6-Bt | H | N(Me)Bu | |
| I-778 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NMe ₃ | |
| I-779 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NMP-c | |
| I-780 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NMP-r-i | |
| I-781 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NtBu | |
| I-782 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NtBu-1 | |
| I-783 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NtBu-t | |
| I-784 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NtPen | |
| I-785 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NH-  | |
| I-786 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃ | |
| I-787 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHCH ₂ CF ₂ CF ₃ | |
| I-788 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHCH ₂ CF ₂ CF ₃ | |
| I-789 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHCH ₂ CH=CH ₂ | |
| I-790 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHCH ₂ C≡CH | |
| I-791 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHCH ₂ CH ₂ OMe | |
| I-792 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHCH ₂ Ph | |
| I-793 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHNCOMe | |
| I-794 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHNCOPh | |
| I-795 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHNOMe | |
| I-796 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHN(OMe) ₂ | |
| I-797 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHPh | |
| I-798 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHPh(2-OMe) | |
| I-799 | CEP ₂ | 6-Bt | H | NHPh(3-OMe) | |

【0057】

【表27】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 比重量折 率(n _D ²⁰) |
|------------|------------------|----------------|----------------|---|---|
| I-800 | CEP ₂ | 6-Et | H | NHPh(4-OMe) | |
| I-801 | CEP ₂ | 6-Pr | H |  | |
| I-802 | CEP ₂ | 6-Pr | H |  | |
| I-803 | CEP ₂ | 6-Pr | H |  | |
| I-804 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(Et)Pr | |
| I-805 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(Et)Bu | |
| I-806 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(Pr-i) ₂ | |
| I-807 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(Bu) ₂ | |
| I-808 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(Bu-i) ₂ | |
| I-809 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(CH ₂ CH ₂ CO) ₂ | |
| I-810 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂ | |
| I-811 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(Me)Et | |
| I-812 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(Me)Pr | |
| I-813 | CEP ₂ | 6-Pr | H | N(Me)Bu | |
| I-814 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHPr-c | |
| I-815 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHBU | |
| I-816 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHBU-i | |
| I-817 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHBU-t | |
| I-818 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHPen | |
| I-819 | CEP ₂ | 6-Pr | H |  | |
| I-820 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHC ₆ H ₁₃ | |
| I-821 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHCH ₂ CH ₂ CH ₃ | |
| I-822 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHCH ₂ CH ₃ | |
| I-823 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHCH ₂ CH=CH ₂ | |
| I-824 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHCH ₂ C≡CH | |
| I-825 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHCH ₂ CH ₂ OMe | |
| I-826 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHCH ₂ Ph | |
| I-827 | CEP ₂ | 6-Pr | H | NHHCOMe | |

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 折光率(n _D ²⁰) |
|------------|-----------------|-----------------------|----------------|--|--|
| I-828 | CH ₂ | 6-Pr | H | NINHCOPh | 1.5291 |
| I-829 | CH ₂ | 6-Pr | H | NINOMe | |
| I-830 | CH ₂ | 6-Pr | H | NIN(OMe) ₂ | |
| I-831 | CH ₂ | 6-Pr | H | NHPh | |
| I-832 | CH ₂ | 6-Pr | H | NHPh(2-OMe) | |
| I-833 | CH ₂ | 6-Pr | H | NHPh(3-OMe) | |
| I-834 | CH ₂ | 6-Pr | H | NHPh(4-OMe) | |
| I-835 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | -N | |
| I-836 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | -NN-Me | |
| I-837 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Bu-1) ₂ | |
| I-838 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(CH ₂ CH ₂ CO) ₂ | |
| I-839 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂ | |
| I-840 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(OMe)Et | |
| I-841 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(OMe)Pr | |
| I-842 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(OMe)Bu | |
| I-843 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPr-c | |
| I-844 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHBu-i | |
| I-845 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHBu-t | |
| I-846 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHC13 | |
| I-847 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHCH ₂ CH ₂ CH ₃ | |
| I-848 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHCH ₂ CH ₃ | |
| I-849 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHCH ₂ CH=CH ₂ | |
| I-850 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHCH ₂ C=CH ₂ | |
| I-851 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHCH ₂ CH ₂ OMe | |
| I-852 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHCH ₂ Ph | |
| I-853 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NINHCOMe | |
| I-854 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NINHCOPh | |
| I-855 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NINOMe | |
| I-856 | CH ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NIN(OMe) ₂ | 140-142 |

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(°C) 折 光率(n _D ²⁰) |
|------------|------------------|-----------------------|----------------|--|--|
| I-857 | CEP ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPh | |
| I-858 | CEP ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPh (2-OMe) | |
| I-859 | CEP ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPh (3-OMe) | |
| I-860 | CEP ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHPh (4-OMe) | |
| I-861 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | -N <chem>C1=CC=CC=C1</chem> | |
| I-862 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | -N <chem>C1=CC=CC=C1</chem> -Me | |
| I-863 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | -N <chem>C1=CC=CC=C1</chem> O | |
| I-864 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Me) ₂ | |
| I-865 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Et) ₂ Pr | |
| I-866 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Et) ₂ Bu | |
| I-867 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Pr) ₂ | |
| I-868 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Pr-i) ₂ | |
| I-869 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Bu) ₂ | |
| I-870 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Bu-i) ₂ | |
| I-871 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (CH ₂ CH ₂ CH ₂) ₂ | |
| I-872 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (CH ₂ CH ₂ CH ₂ ORt) ₂ | |
| I-873 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Me) ₂ Et | |
| I-874 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Me) ₂ Pr | |
| I-875 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | N (Me) ₂ Bu | |
| I-876 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | NMe | |
| I-877 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | NHRT | |
| I-878 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | NHPr-c | |
| I-879 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | NHPr-1 | |
| I-880 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | NHBu | |
| I-881 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | NHBu-1 | |
| I-882 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | NHBu-t | |
| I-883 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | NHPen | |
| I-884 | CEP ₂ | 6-CH ₂ ORt | H | NH <chem>C1=CC=CC=C1</chem> | |

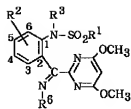
【0060】

【表30】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R | 融 点(℃) 折 射 率(n _D ²⁰) |
|------------|------------------|-----------------------|----------------|---|--|
| I-885 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHC ₆ H ₁₃ | |
| I-886 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHCH ₂ CF ₂ CF ₃ | |
| I-887 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHCH ₂ CF ₃ | |
| I-888 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHCH ₂ CH=CH ₂ | |
| I-889 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHCH ₂ C=CH | |
| I-890 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHCH ₂ CH ₂ OMe | |
| I-891 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHCH ₂ Ph | |
| I-892 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NENHOMe | |
| I-893 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NENHOPh | |
| I-894 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NENHMe | |
| I-895 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NNN(Me) ₂ | |
| I-896 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHPh | |
| I-897 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHPh(2-OMe) | |
| I-898 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHPh(3-OMe) | |
| I-899 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OEt | H | NHPh(4-OMe) | |
| I-900 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(St)Pr | |
| I-901 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me)CH ₂ C=CH | 102-103 |
| I-902 | CHF ₂ | H | H | NH ₂ | 166-168 |

【0061】

【表31】



| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁶ | 融 点(°C) 及 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|----------------|----------------|--------------------------------------|--|
| 11-1 | CH ₂ F | H | H | OMe | |
| 11-2 | CH ₂ F | H | H | ORt | |
| 11-3 | CH ₂ F | H | H | OH | |
| 11-4 | CH ₂ F | H | H | Ph | |
| 11-5 | CH ₂ F | H | H | Ph(2-Cl) | |
| 11-6 | CH ₂ F | H | H | NHMe | |
| 11-7 | CH ₂ F | 4-Cl | H | NHSO ₂ CH ₂ F | |
| 11-8 | CH ₂ F | H | H | N(Me) ₂ | |
| 11-9 | CH ₂ F | H | H | Me | |
| 11-10 | CH ₂ Br | H | H | OMe | |
| 11-11 | CH ₂ Br | H | H | ORt | |
| 11-12 | CH ₂ Br | H | H | OH | |
| 11-13 | CH ₂ Br | H | H | Ph | |
| 11-14 | CH ₂ Br | H | H | Ph(2-Cl) | |
| 11-15 | CH ₂ Br | H | H | NHMe | |
| 11-16 | CH ₂ Br | 4-Cl | H | NHSO ₂ CH ₂ Br | |
| 11-17 | CH ₂ Br | H | H | N(Me) ₂ | |
| 11-18 | CH ₂ Br | H | H | Me | |
| 11-19 | CH ₂ Cl | H | H | OMe | |
| 11-20 | CH ₂ Cl | H | H | ORt | |
| 11-21 | CH ₂ Cl | H | H | OH | |
| 11-22 | CH ₂ Cl | H | H | Ph | |
| 11-23 | CH ₂ Cl | H | H | Ph(2-Cl) | |
| 11-24 | CH ₂ Cl | H | H | NHMe | |
| 11-25 | CH ₂ Cl | 4-Cl | H | NHSO ₂ CH ₂ Cl | |

【0062】

【表32】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁵ | 融 点(℃) 比 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|----------------|----------------|-------------------------------------|---|
| 11-26 | CH ₂ Cl | H | H | N(Me) ₂ | 129-130 |
| 11-27 | CH ₂ Cl | H | H | Me | |
| 11-28 | CH ₂ CN | H | H | OMe | |
| 11-29 | CH ₂ CN | H | H | OBt | |
| 11-30 | CH ₂ CN | H | H | OH | |
| 11-31 | CH ₂ CN | H | H | Ph | |
| 11-32 | CH ₂ CN | H | H | Ph(2-Cl) | |
| 11-33 | CH ₂ CN | H | H | NEMe | |
| 11-34 | CH ₂ CN | 4-Cl | H | NEO ₂ CH ₂ CN | |
| 11-35 | CH ₂ CN | H | H | N(OMe) ₂ | |
| 11-36 | CH ₂ CN | H | H | Me | |
| 11-37 | CH ₂ F | H | H | OMe | |
| 11-38 | CH ₂ F | H | H | OBt | |
| 11-39 | CH ₂ F | H | H | OH | |
| 11-40 | CH ₂ F | H | H | Ph | |
| 11-41 | CH ₂ F | H | H | Ph(2-Cl) | |
| 11-42 | CH ₂ F | H | H | NEMe | |
| 11-43 | CH ₂ F | 4-Cl | H | NEO ₂ CH ₂ F | |
| 11-44 | CH ₂ F | H | H | N(OMe) ₂ | |
| 11-45 | CHCl ₂ | H | H | Me | |
| 11-46 | CHCl ₂ | H | H | OMe | |
| 11-47 | CHCl ₂ | H | H | OBt | |
| 11-48 | CHCl ₂ | H | H | OH | |
| 11-49 | CHCl ₂ | H | H | Ph | |
| 11-50 | CHCl ₂ | H | H | Ph(2-Cl) | |
| 11-51 | CHCl ₂ | H | H | NEMe | |
| 11-52 | CHCl ₂ | 4-Cl | H | NEO ₂ CHCl ₂ | |
| 11-53 | CHCl ₂ | H | H | N(OMe) ₂ | |
| 11-54 | CHCl ₂ | H | H | Me | |
| 11-55 | CF ₃ | H | H | OMe | 88-91 |
| 11-56 | CF ₃ | H | H | OBt | 106-107 |

【0063】

【表33】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁵ | 融 点(°C) 比 重(d ₄ ²⁰) |
|------------|-------------------------|----------------|----------------|---|---|
| 11-57 | CF ₃ | H | H | OH | 216-217 |
| 11-58 | CF ₃ | H | H | Ph | 131-132 |
| 11-59 | CF ₃ | H | H | Ph (2-Cl) | 123-124 |
| 11-60 | CF ₃ | H | H | NMe | 79- 81 |
| 11-61 | CF ₃ | 4-Cl | H | NH ₂ CF ₃ | |
| 11-62 | CF ₃ | H | H | N(Me) ₂ | 121-122 |
| 11-63 | CF ₃ | H | H | Me | 175-177 |
| 11-64 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | OMe | |
| 11-65 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | OBt | |
| 11-66 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | OH | |
| 11-67 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | Ph | |
| 11-68 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | Ph (2-Cl) | |
| 11-69 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | NMe | |
| 11-70 | CH ₂ CH=CHCl | 4-Cl | H | NH ₂ CH ₂ CH=CHCl | |
| 11-71 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | N(Me) ₂ | |
| 11-72 | CH ₂ CH=CHCl | H | H | Me | |
| 11-73 | CHF ₂ | 3-F | H | Ph | |
| 11-74 | CHF ₂ | 3-F | H | Bt | |
| 11-75 | CHF ₂ | 3-F | H | Pr-i | |
| 11-76 | CHF ₂ | 3-F | H | Pr | |
| 11-77 | CHF ₂ | 3-F | H | Me | |
| 11-78 | CHF ₂ | 3-F | H | N(Me) ₂ | 112-113 |
| 11-79 | CHF ₂ | 3-F | H | NH ₂ | |
| 11-80 | CHF ₂ | 3-F | H | NMe | 123-124 |
| 11-81 | CHF ₂ | 3-F | H | NH ₂ CHF ₂ | |
| 11-82 | CHF ₂ | 6-Et | H | Ph | |
| 11-83 | CHF ₂ | 6-Et | H | Bt | |
| 11-84 | CHF ₂ | 6-Et | H | Pr-i | |
| 11-85 | CHF ₂ | 6-Et | H | Pr | |
| 11-86 | CHF ₂ | 6-Et | H | Me | |
| 11-87 | CHF ₂ | 6-Et | H | N(Me) ₂ | |
| 11-88 | CHF ₂ | 6-Et | H | NH ₂ | |

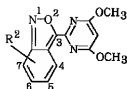
【0064】

【表34】

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁶ | 融 点(°C) 結晶 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|------------------|-----------------------|----------------|------------------------------------|---|
| 11-89 | CHF ₂ | 6-Et | H | NHMe | 1.5802 |
| 11-90 | CHF ₂ | 6-Et | H | NHSO ₂ CHF ₂ | |
| 11-91 | CHF ₂ | 6-Pr | H | Ph | |
| 11-92 | CHF ₂ | 6-Pr | H | Et | |
| 11-93 | CHF ₂ | 6-Pr | H | Pr-i | |
| 11-94 | CHF ₂ | 6-Pr | H | Pr | |
| 11-95 | CHF ₂ | 6-Pr | H | Me | |
| 11-96 | CHF ₂ | 6-Pr | H | N(Me) ₂ | |
| 11-97 | CHF ₂ | 6-Pr | H | NH ₂ | |
| 11-98 | CHF ₂ | 6-Pr | H | NHMe | |
| 11-99 | CHF ₂ | 6-Pr | H | NHSO ₂ CHF ₂ | |
| 11-100 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Ph | 1.5802 |
| 11-101 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Et | |
| 11-102 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Pr-i | |
| 11-103 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Pr | |
| 11-104 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Me | |
| 11-105 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 11-106 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NH ₂ | |
| 11-107 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHMe | |
| 11-108 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHSO ₂ CHF ₂ | |
| 11-109 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Ph | |
| 11-110 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Et | |
| 11-111 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Pr-i | |
| 11-112 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Pr | |
| 11-113 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | Me | |
| 11-114 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | N(Me) ₂ | |
| 11-115 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NH ₂ | |
| 11-116 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHMe | |
| 11-117 | CHF ₂ | 6-CH ₂ OMe | H | NHSO ₂ CHF ₂ | 1.28-131 |
| 11-118 | CHF ₂ | 5-F | H | Me | |
| 11-119 | CHF ₂ | H | H | Ba | |
| 11-120 | CHF ₂ | H | H | Et | |

【0065】

【表35】



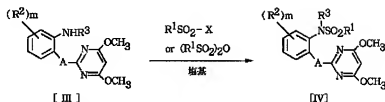
| 化合物 番 号 | R ² | 融 点(℃) ± 屈折率(n _D ²⁰) |
|------------|-----------------------|---|
| III- 1 | H | |
| III- 2 | 4-F | 145 - 147 |
| III- 3 | 5-F | |
| III- 4 | 6-F | |
| III- 5 | 7-F | |
| III- 6 | 4-Cl | |
| III- 7 | 5-Cl | 188-200 |
| III- 8 | 6-Cl | |
| III- 9 | 7-Cl | |
| III-10 | 4-Me | |
| III-11 | 5-Me | |
| III-12 | 6-Me | |
| III-13 | 7-Me | |
| III-14 | 4-OMe | |
| III-15 | 5-OMe | |
| III-16 | 6-OMe | |
| III-17 | 7-OMe | |
| III-18 | 4-CH ₂ OMe | |
| III-19 | 5-CH ₂ OMe | |
| III-20 | 6-CH ₂ OMe | |
| III-21 | 7-CH ₂ OMe | 126-127 |

【0066】次に、一般式【I】で示される本発明化合物は、以下に示す製造法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

【0067】＜製造法1＞

【0068】

【化5】



(式中、Aは基-C(=O)-、基-CH(OH)-又はQ[ここでQは前記と同じ意味を示す。]を示し、Xはハロゲン原子を示し、R¹、R²、R³、mは前記と同じ意味を示す。)

【0069】一般式【I】で示されるアニリン誘導体1モルに対し、スルホンヒドライド誘導体もしくはスルホン酸誘導体の無水物1～2倍モルを無溶媒、或いは適当な溶媒0.5～5l中、塩基1～2倍モルの存在下で反応させることにより、一般式【IV】で示される目的のスルホンアニリド誘導体を得ることができる。

【0070】ここで溶媒としてはn-ヘキサン等の炭化水素、シクロヘキサン等の環状炭化水素、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)等のアミド類、N,N-

-ジメチルスルホキシド(DMSO)、スルホラン等の硫黄化合物、キノリン、ビリジンの芳香族含窒素化合物、N,N-ジエチルアニリン等のアニリン誘導体、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素、アセトニトリル等のニトリル類、ニトロベンゼン等の芳香族ニトロ化合物類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水等を例示できる。

【0071】また、塩基としては、水素化ナトリウム等の金属水素化合物、n-ブチルリチウム等の有機金属化合物、ビリジン、トリエチルアミン等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属またはアルカリ土類金属の炭酸化合物、同水酸化化合物、同炭酸水素化合物、さらにナトリウムメトキシド、カリウムメトキシド等のアルコールの金属塩

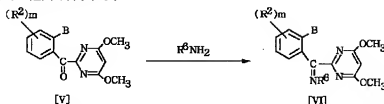
等を例示できる。

【0072】反応温度は -70°C ～ 250°C の温度範囲で行い、好ましくは -20°C から室温の温度範囲であり、反応時間は5分から1週間で終了する。

【0073】<製造法2>

【0074】

【化6】



(式中、Bは基 $-\text{NHR}^3$ 、基 $-\text{NR}^3(\text{SO}_2\text{R}^1)$ 又はニトロ基を示し、m, R^1 , R^2 , R^3 , R^6 は前記と同意味を示す。)

【0075】一般式【V】で示されるカルボニル化合物1モルに対し、 R^6NH_2 で示されるアミン類1～5倍モルを無溶媒又は適当な溶媒(ベンゼン等の芳香族炭化水素類、メタノール等のアルコール類等を例示できる。)0.5～5.1中で、脱水縮合させる事により、一般式【VI】で示される目的のイミン化合物を得ること

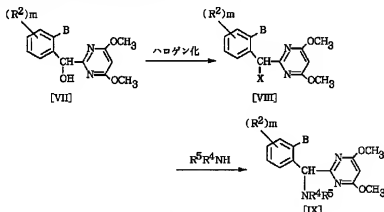
ができる。ここで、場合により適当な触媒(四塩化チタン等のルイス酸類、酢酸カリウム等の塩基類等を例示できる。)0.01～2倍モルを添加しても良い。

【0076】反応温度は -70°C ～ 250°C の温度範囲で行い、好ましくは -20°C から 150°C の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0077】<製造法3>

【0078】

【化7】



(式中、m, B, R^2 , R^4 , R^5 , Xは前記と同じ意味を示す。)

【0079】一般式【VII】で示される化合物1モルの水酸基を、無溶媒又は適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5～5.1中で、ハロゲン化剤(塩化チオニル等のハロゲン化硫黄類を例示できる。)1～5倍モルを用いてハロゲン化して一般式【VII】で示される化合物を得た後、無溶媒又は適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5～5.1中、一般式 $\text{R}^4\text{R}^5\text{NH}$ で示されるアミン類1～5倍モルと反応させることにより、一般式【IX】で示される目的のアミン化合物を得ることができる。ここで、場合により適当な塩基(水素化ナトリウム等の金属水素化物、n-ブチルリ

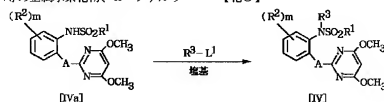
チウム等の有機金属化合物、ビリジン、トリエチルアミン等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属またはアルカリ土類金属の炭酸化合物、同水酸化化合物、同炭酸水素化合物、さらにナトリウムメトキシド、カリウムメトキシド等のアルコールの金属塩等を例示できる。)1～5倍モルを添加しても良い。

【0080】反応温度は -70°C ～ 250°C の温度範囲で行い、好ましくは -20°C から 100°C の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0081】<製造法4>

【0082】

【化8】



(式中、L² はハロゲン原子又はアルキルスルホニル基等の脱離基を示し、m、R²、R³、Xは前記と同じ意味を示す。)

【0088】<製造法5>

一般式【XII】及び【XIV】で示される中間体の製造法。

【0089】一般式【Xa】又は【XIII】で示されるベンジルシアニド誘導体1モルと、一般式【XIa】で示されるビリミジン誘導体1〜2倍モルとを無溶媒または適当な溶媒（製造法1に記載と同様である。）0.5〜51中で、適当な塩基（製造法1に記載と同様である。）1〜5倍モルの存在下で縮合させることにより、目的の一般式【XII】又は【XIV】で示される化合物を得ることができる。

【0090】あるいは、一般式【Xb】で示されるニトロ化合物1モルと、一般式【XIb】で示されるビリミジン誘導体1〜2倍モルとを無溶媒または適当な溶媒（製造法1に記載と同様である。）0.5〜51中で、適当な塩基（製造法1に記載と同様である。）1〜5倍モルの存在下で縮合させることにより、目的の一般式【XII】で示される化合物を得ることができる。

【0091】いずれの場合も反応温度は−70℃から250℃の温度範囲で行い、好ましくは−20℃から100℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0092】<製造法6>

一般式【Va】及び【Vc】で示される中間体の製造法。

【0093】一般式【XII】又は【XIV】で示されるシアン化合物1モルを、適当な溶媒（製造法1に記載と同様である。）0.5〜51中、酸化剤（m-クロロ過安息香酸等の有機過酸類などを例示できる。）1〜2倍モルで処理した後、適当な溶媒（水などを例示できる。）0.5〜51中、適当な塩基（水酸化ナトリウム等のアルカリ金属類などを例示できる。）1〜10倍モルと処理することにより酸化的脱シアノ化反応を行い、一般式【Va】又は【Vc】で示される目的のカルボニル化合物を得ることができる。

【0094】反応温度は−70℃から溶媒の沸点の温度範囲で行い、好ましくは−20℃から100℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0095】<製造法7>

一般式【II】で示される4,6-ジメトキシビリミジン誘導体の製造法。

【0096】一般式【Vc】で示されるカルボニル化合物1モルを、適当な溶媒（N、N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、N、N-ジメチルスルホキシド（DMF）、スルホラン等の硫黄化合物などを例示できる。）0.5〜51中、アジ化ナトリウム等1〜5倍モルと処理することにより、一般式【II】で示される目

的の4,6-ジメトキシビリミジン誘導体を得ることができる。

【0097】反応温度は−70℃から溶媒の沸点の温度範囲で行い、好ましくは−20℃から150℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0098】<製造法8>

一般式【Vb】及び【VIIb】で示される中間体の製造法。

【0099】一般式【II】で示される4,6-ジメトキシビリミジン誘導体あるいは一般式【Va】、【VIIa】で示されるニトロ化合物1モルを、適当な溶媒（製造法1に記載と同様である。）0.5〜51中、適当な還元剤（鉄等の金属類などを例示できる。）1〜5倍モルで還元することにより、対応する一般式【Vb】及び【VIIb】で示される目的のアミノ化合物を得ることができる。場合により触媒として酸（酢酸等の有機酸類などを例示できる。）0.01〜1倍モルを添加しても良い。

【0100】あるいは、一般式【II】で示される4,6-ジメトキシビリミジン誘導体あるいは一般式【Va】、【VIIa】で示されるニトロ化合物1モルを、適当な溶媒（製造法1に記載と同様である。）0.5〜51中、触媒（パラジウム等の金属類などを例示できる。）0.01〜1倍モルの存在下で、適当な還元剤（ギ酸アンモニウムあるいは水素などを例示できる。）1〜5倍モルで還元することにより、対応する一般式【Vb】及び【VIIb】で示される目的のアミノ化合物を得ることができる。

【0101】いずれの場合も、反応温度は−70℃から溶媒の沸点の温度範囲で行い、好ましくは−20℃から100℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0102】<製造法9>

一般式【VIIa】、【VIIb】あるいは【VIIc】で示される中間体の製造法。

【0103】一般式【Va】、【Vb】あるいは【Vd】で示されるカルボニル化合物1モルを、適当な溶媒（製造法1に記載と同様である。）0.5〜51中、適当な還元剤（水素化ホウ素ナトリウム等のアルカリ金属水素化錯化合物類などを例示できる。）1〜5倍モルで還元することにより、対応する一般式【VIIa】、【VIIb】あるいは【VIIc】で示される目的のアルコール化合物を得ることができる。

【0104】反応温度は−70℃から溶媒の沸点の温度範囲で行い、好ましくは−20℃から100℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0105】<製造法10>

一般式【Vd】で示される中間体の製造法。

【0106】一般式【Vc】で示される化合物1モルを、無溶媒又は適当な溶媒（製造法1に記載と同様であ

る。)0.5〜5ml中で、一般式 R^3NH_2 で示されるアミン類1〜5倍モルと反応させることにより、一般式[Vd]で示される目的のアミン化合物を得ることができ。

【0107】反応温度は−70℃から250℃の温度範囲で行い、好ましくは−20℃から150℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間を終了する。

【0108】なお、上述の中間体の合成に関しては、ジャーナル・オブ・ケミカル・リサーチ(S)(J. Chem. Research(S))第186頁(1977年)、ヘテロサイクルズ(Heterocycles)第38巻(1)、第125頁(1994年)及びWO94/08975号公報明細書等に類似の反応例が記載されている。

【0109】

【実施例】次に、実施例をあげて本発明化合物の製造法、製剤法及び用途を具体的に説明する。尚、本発明化合物の製造中間体の製造法も合わせて記載する。

【0110】<実施例1>

2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]-1,1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号I-296)の製造

【0111】(1)2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]アニリン(化合物II)の製造

2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]-1-ヒドロキシメチル]アニリン2.0g(7.7ミリモル)をクロロホルム30mlに溶解し、0℃にて攪拌しつつ塩化チオニル1.0g(8.4ミリモル)を滴下した。0℃から室温にて30分攪拌後、室温にてモルホリン1.4g(16ミリモル)を滴下し、室温にて30分攪拌した後、さらに加熱還流下30分攪拌した。反応液を5%塩酸水にて抽出し、抽出液を飽和重曹水で中和後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、淡褐色結晶性液体の2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]アニリン0.5g(収率20%)を得た。

【0112】(2)2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]-1,1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号I-296)の製造

2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]アニリン0.5g(1.5ミリモル)、ピリジン0.3g(3.8ミリモル)をクロロホルム15mlに溶解し、室温にて攪拌しながら1,1-ジフルオロメタンスルホン酸クロリド

0.6g(4.0ミリモル)を滴下した。室温にて3時間攪拌を続けた後、反応液を氷水中にかけ、クロロホルムで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、白色粉末(融点:143〜144℃)の2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]-1,1-ジフルオロメタンスルホンアニリド0.3g(収率45%)を得た。

【0113】<実施例2>

2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(メトキシミノ)メチル]-1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号II-55)の製造

【0114】(1)2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド(化合物V)の製造
2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン3.0g(11.6ミリモル)、トリエチルアミン1.5g(14.8ミリモル)をジクロロメタン50mlに溶解し、0℃にて攪拌しながら1,1,1-トリフルオロメタンスルホン酸無水物3.9g(13.8ミリモル)を約10分間で滴下し、そのまま1時間攪拌を続けた。反応液を氷水中にかけ5%水酸化ナトリウム水溶液(20ml)で2回抽出し、水層を集め、10%塩酸で酸性とした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した粗結晶をジソプロピルエーテルで洗浄し、黄白色粉末(融点:102〜104℃)の2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド3.0g(収率69%)を得た。

【0115】(2)2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(メトキシミノ)メチル]-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号II-55)の製造
2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド3.0g(7.7ミリモル)、酢酸カリウム4.0g(40.8ミリモル)及びメトキシアンミン塩酸塩4.0g(47.9ミリモル)をエタノール50mlに懸濁させ、加熱還流下にて攪拌した。反応液を氷水中にかけ酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、白色結晶(融点:89〜91℃)の2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-

(メトキシミノ)メチル]-1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホンアニリド0.9g(収率28%)を得た。

【0116】<実施例3>

2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(エチルアミノ)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号I-359)の製造

【0117】(1) 2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-ヒドロキシメチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(化合物VII)の製造

2-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-ヒドロキシメチル]-6'-メトキシメチルアニリン4.0g(1.3ミリモル)及びピリジン2.0g(25.3ミリモル)をジクロロメタン30mlに溶解させ、室温にて攪拌しながら1, 1-ジフルオロメタンスルホン酸クロリド3.6g(23.9ミリモル)を滴下した。室温にて7日間攪拌を続けた後、反応液を氷水中にかけ、ジクロロメタンで抽出した。有機層を5%塩酸水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、無色粒状結晶(融点76~77℃)の2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-ヒドロキシメチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド2.0g(収率36%)を得た。

【0118】(2) 2'-[1-クロロ-1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(化合物VIII)の製造

2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-ヒドロキシメチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド2.0g(4.8ミリモル)及び塩化チオニル0.7g(5.9ミリモル)をクロロホルム15mlに溶解させ、室温にて2時間攪拌を続けた。溶媒及び過剰の塩化チオニルを減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、淡黄色結晶(融点88~89℃)の2'-[1-クロロ-1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド2.0g(収率95%)を得た。

【0119】(3) 2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(エチルアミノ)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号I-359)の製造

2'-[1-クロロ-1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド1.0g(2.3ミリモル)をテトラヒドロフラン10mlに溶解させ、室温にて攪拌しながらエチルアミン0.3g(6.7ミリモル)を滴下した。室温にて1時間攪拌を続けた後、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:1)で精製し、淡赤色粉末(融点188~189℃)の2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(エチルアミノ)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド0.9g(収率88%)を得た。

【0120】<実施例4>

N-メトキシメチル-2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(ジエチルアミノ)メチル]-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号I-256)の製造

2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(ジエチルアミノ)メチル]-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド0.8g(1.9ミリモル)及び炭酸カリウム1.0g(7.2ミリモル)をN, N-ジメチルホルムアミド15mlに懸濁させ、室温にて攪拌しながらクロロメチルメチルエーテル0.5g(6.2ミリモル)を滴下した。室温にて3時間攪拌を続けた後、反応液を氷水中にかけ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5)で精製し、無色結晶(融点67~69℃)のN-メトキシメチル-2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(ジエチルアミノ)メチル]-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド0.8g(収率91%)を得た。

【0121】<実施例5>

3-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-フルオロ-2, 1-ベンゾイソオキサゾール(本発明化合物番号I11-2)の製造
2-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)-4, 6-ジメトキシピリミジン 4.0g(14.3ミリモル)およびアジ化ナトリウム1.1g(16.9ミリモル)をN, N-ジメチルホルムアミド30mlに溶解させ、120℃で3時間攪拌した。反応液を室温に戻して氷水中にかけ、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄後、乾燥した。溶媒を減圧留去し、結晶残渣をジソプロピルエーテルにて洗浄して赤色粉末(融点145~147℃)の3-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-フルオロ-2, 1-ベンゾイソオキサゾール1.8g(収率46%)を得た。

【0122】(中間体の製造例)

<参考例1>

(1) 2-(2-ニトロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル(化合物X I I)の製造

2-(2-ニトロフェニル)アセトニトリル50 g (0.31モル)を500 mlのN,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、60%水素化ナトリウム24.7 g (0.62モル)を添加し、室温にて2時間撹拌した。次に2-メチルスルホニル-4,6-ジメトキシビリミジン67.7 g (0.31モル)を加え、80℃で1時間撹拌した。反応液を水にあげ、10%塩酸水で中和した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をエタノールより結晶化し、白色粉末(融点88~89℃)の2-(2-ニトロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル73.3 g (収率79%)を得た。

【0123】(2) 2-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル(化合物X I V)の製造
2-(2,6-ジフルオロフェニル)アセトニトリル12 g (78ミリモル)を100 mlのN,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、60%水素化ナトリウム6.3 g (0.16モル)を添加し、室温にて2時間撹拌した。次に2-メチルスルホニル-4,6-ジメトキシビリミジン17 g (78ミリモル)を加え、80℃で1時間撹拌した。反応液を水にあげ、10%塩酸水で中和した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、無色アメリ状物質の2-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル19 g (収率83%)を得た。

【0124】(3) 2-(4-フルオロ-2-ニトロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル(化合物X I I)の製造
60%水素化ナトリウム11.2 g (0.28モル)をN,N-ジメチルホルムアミド100 mlに懸濁させ氷水浴で10℃以下に冷却し、撹拌しながら2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル25 g (0.14モル)のN,N-ジメチルホルムアミド100 ml溶液を滴下した。室温にて2時間撹拌後、反応液を氷水にあげ10%塩酸水で酸性にした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧

留去した。析出した粗結晶をエタノール/イソプロピルエーテル混合溶媒で洗浄し、無色粒状結晶(融点111~112℃)の2-(4-フルオロ-2-ニトロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル42 g (収率94%)を得た。

【0125】同様に(1)及び(3)の方法で以下に示す化合物(化合物X I I)を得た。

2-(3-メチル-2-ニトロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル: 淡赤色粒状結晶(融点108~110℃)
2-(3-エチル-2-ニトロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル: 茶褐色粉末(融点113~114℃)
2-(3-メトキシメチル-2-ニトロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル: 赤褐色粉末(融点112~113℃)

【0126】<参考例2>

(1) 5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン(化合物V a)の製造

2-(4-フルオロ-2-ニトロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル3.2 g (10ミリモル)、m-クロロ過安息香酸(50%)6.0 g (17ミリモル)をクロロホルム30 mlに溶解させ、室温にて12時間撹拌した。ついで10%水酸化ナトリウム水溶液15 mlを加え室温にて1時間撹拌した後、クロロホルム50 mlを加え抽出した。有機層を5%塩酸水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5)で精製し、白色粒状結晶(融点187~189℃)の5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン2.7 g (収率88%)を得た。

【0127】(2) 2-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-4,6-ジメトキシビリミジン(化合物V c)の製造

2-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)アセトニトリル19 g (65ミリモル)、m-クロロ過安息香酸(50%)30 g (87ミリモル)をクロロホルム150 mlに溶解させ、加熱還流下6時間撹拌した。ついで室温に戻し10%水酸化ナトリウム水溶液15 mlを加え室温にて2時間撹拌した後、クロロホルム50 mlを加え抽出した。有機層を5%塩酸水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、白色結晶(融点104~105℃)の2-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-4,6-ジメトキシビリミジン13 g

(収率71%)を得た。

【0128】同様の方法で以下に示す化合物(化合物Va)を得た。

2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン: 淡褐色結晶(融点164~165℃)

6-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン: 淡褐色粒状結晶(融点181~183℃)

6-メチル-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン: 無色粒状結晶(融点166~171℃)

6-エチル-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン: 白色粉末(融点116~117℃)

6-メトキシメチル-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン: 白色粉末(融点111~113℃)

【0129】<参考例3>

(1) 5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン(化合物Vb)の製造

5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン3.1g(10ミリモル)、鉄粉3g(54ミリモル)、水20ml、酢酸エチル150ml及び酢酸1mlの混合物を加熱還流下5時間撹拌した。反応液中の不溶物をろ過剤を用いて除去し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した粗結晶をジソプロピルエーテルで洗浄し、淡黄色粒状結晶(融点177~179℃)の5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン2.4g(収率87%)を得た。

【0130】(2) 3-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン(化合物Vb)の製造

3-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)-4-フルオロ-2,1-ベンゾイソキサゾール1.2g(4.4ミリモル)、パラジウム炭素0.1g及びギ酸アモニウム0.8g(12.7ミリモル)をメタノール100mlに懸濁させ加熱還流下1時間撹拌した。反応液中の不溶物をろ別し、メタノールを減圧留去後100mlの水を加え酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した粗結晶をジソプロピルエーテルで洗浄し、黄色粒状結晶(融点129~130℃)の3-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン1.1g(収率91%)を得た。

【0131】同様に(1)の方法で以下に示す化合物(化合物Vb)を得た。

2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン: 黄色結晶(融点166~167℃)

6-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン: 黄色粒状結晶(融点131~134℃)

6-メチル-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン: 黄色粒状結晶(融点130~132℃)

6-エチル-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン: 黄色粉末(融点122~123℃)

6-メトキシメチル-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン: 蛍光黄色結晶(融点100~101℃)

【0132】<参考例4>

1-(2-アミノ-4-フルオロフェニル)-1-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)メタノール(化合物VIIb)の製造

5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イルカルボニル)アニリン1.1g(4.0ミリモル)をテトラヒドロフラン:水=1:1の混合溶媒50mlに溶解させ、室温で撹拌しながら水素化ホウ素ナトリウム0.3g(7.9ミリモル)を加え、さらに2時間室温で撹拌を続けた。氷水50mlを加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウム乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した粗結晶をジソプロピルエーテルで洗浄し、無色粒状結晶(融点94~95℃)の1-(2-アミノ-4-フルオロフェニル)-1-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)メタノール1.0g(収率90%)を得た。

【0133】同様の方法で以下に示す化合物(化合物VIIb)を得た。

1-(2-アミノフェニル)-1-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)メタノール: 白色粉末(融点78~80℃)

1-(2-アミノ-3-フルオロフェニル)-1-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)メタノール: 無色粒状結晶(融点92~94℃)

1-(2-アミノ-6-フルオロフェニル)-1-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)メタノール: 白色粉末(融点109~110℃)

1-(2-アミノ-3-メチルフェニル)-1-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)メタノール: 無色粒状結晶(融点109~112℃)

1-(2-アミノ-3-エチルフェニル)-1-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)メタノール: 白色結晶(融点85~86℃)

1-(2-アミノ-3-メトキシメチルフェニル)-1-(4,6-ジメトキシビリミジン-2-イル)メタノール

ル：白色結晶（融点40～42℃）

【0134】本発明の除草剤は、一般式【I】で示されるスルホンアニリド誘導体を有効成分とする。

【0135】本発明化合物を除草剤として使用するには本発明化合物それ自体で用いてもよいが、製剤化に一般的に用いられる担体、界面活性剤、分散剤又は補助剤等を配合して、粉剤、水和剤、乳剤、微粒剤又は粒剤等に製剤して使用することもできる。

【0136】製剤化に際して用いられる担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレイ、カオリン、珪藻土、ホワイトカーボン、パーミキュライト、炭酸カルシウム、消石灰、珪砂、硫酸、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサン、メチルナフテン等の液体担体等があげられる。

【0137】界面活性剤又は分散剤としては、例えばアルキルベンゼンスルホン酸金属塩、ジナフチルメタンジスルホン酸金属塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩ホルマリン縮合物、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等があげられる。

【0138】補助剤としては、例えばカルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴム等があげられる。

【0139】使用に際しては適当な濃度に希釈して散布するか又は直接施用する。

【0140】本発明の除草剤は葉面散布、土壌施用又は水面施用等により使用することができる。有効成分の配合割合については必要に応じて適宜選ばれるが、粉剤又は粒剤とする場合は0.01～10%（重量）、好ましくは0.05～5%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤及び水和剤とする場合は1～50%（重量）、好ましくは5～30%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。

【0141】本発明の除草剤の施用量は使用される化合物の種類、対象雑草、発生傾向、環境条件ならびに使用する剤型等によってかわるが、粉剤又は粒剤のようにそのまま使用する場合は、有効成分として10アル当り0.1g～5kg、好ましくは1g～1kgの範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤又は水和剤のように液状で使用する場合は、0.1～50,000ppm、好ましくは10～10,000ppmの範囲から適宜選ぶのがよい。

【0142】また、本発明化合物は必要に応じて殺虫剤、殺菌剤、他の除草剤、植物生長調節剤、肥料等と混用してもよい。

【0143】次に代表的な製剤例をあげて製剤方法を具体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率は、これのみに限定されることなく広い範囲で変更可能

である。以下の説明において「部」は重量部を意味する。

【0144】〈製剤例1〉 水和剤
化合物（I-253）の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、β-ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、クレイの69部を混合粉砕し、水和剤を得る。

【0145】〈製剤例2〉 水和剤
化合物（I-353）の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、β-ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、ホワイトカーボンの5部、クレイの64部を混合粉砕し、水和剤を得る。

【0146】〈製剤例3〉 水和剤
化合物（I-367）の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、β-ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、ホワイトカーボンの5部、炭酸カルシウムの64部を混合粉砕し、水和剤を得る。

【0147】〈製剤例4〉 乳剤
化合物（I-335）の30部にキシレンとイソホロンの等量混合物60部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物の10部を加え、これらをよくかきまぜることによって乳剤を得る。

【0148】〈製剤例5〉 粒剤
化合物（I-269）の10部、タルクとベントナイトを1：3の割合で混合した増量剤の80部、ホワイトカーボンの5部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物の5部に水10部を加え、よく練ってペースト状としたものを直径0.7mmのふるいびから押し出して乾燥した後に0.5～1mmの長さに切断し、粒剤を得る。

【0149】次に試験例をあげて本発明化合物の奏する効果を説明する。

【0150】〈試験例1〉 水田湛水処理による除草効果試験

100cm²のアラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、タイヌビエ（Ec）、コナギ（Mo）及びホタルイ（Sc）の各種子を播種し、水深3cmに湛水した。翌日、製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、水面に滴下処理した。施用量は、有効成分を10アル当り100gとした。その後、温室内で育成し、処理後28日目に表36の基準に従って除草効果を調査した。結果を表37～表43に示す。

【0151】

【表36】

| 指数 | 除草効果（生育抑制程度）及び被害 |
|----|---------------------------|
| 5 | 無処理区に対し90%以上の抑制の除草効果、被害 |
| 4 | 無処理区に対し70%以上90%未満の除草効果、被害 |
| 3 | 無処理区に対し50%以上70%未満の除草効果、被害 |
| 2 | 無処理区に対し30%以上50%未満の除草効果、被害 |
| 1 | 無処理区に対し10%以上30%未満の除草効果、被害 |
| 0 | 無処理区に対し0%以上10%未満の除草効果、被害 |

【0152】

【表37】

| 化合物番号 | 除 草 効 果 | | |
|-------|---------|-----|-----|
| | E c | M o | S c |
| I-1 | 5 | 5 | 5 |
| I-2 | 5 | 5 | 5 |
| I-3 | 5 | 5 | 5 |
| I-4 | 5 | 5 | 5 |
| I-7 | 5 | 5 | 5 |
| I-253 | 5 | 5 | 5 |
| I-256 | 3 | 5 | 5 |
| I-257 | 5 | 5 | 5 |
| I-258 | 5 | 5 | 5 |
| I-259 | 5 | 5 | 5 |
| I-260 | 5 | 5 | 5 |
| I-261 | 5 | 5 | 5 |
| I-262 | 5 | 5 | 5 |
| I-263 | 5 | 5 | 5 |
| I-264 | 5 | 5 | 5 |
| I-265 | 5 | 5 | 5 |
| I-266 | 5 | 5 | 5 |
| I-267 | 5 | 5 | 5 |
| I-268 | 5 | 5 | 5 |
| I-269 | 5 | 5 | 5 |
| I-270 | 5 | 5 | 5 |
| I-271 | 5 | 5 | 5 |
| I-272 | 5 | 5 | 5 |
| I-273 | 5 | 5 | 5 |
| I-274 | 5 | 5 | 5 |
| I-275 | 5 | 5 | 5 |
| I-276 | 5 | 5 | 5 |
| I-277 | 5 | 5 | 5 |
| I-278 | 5 | 5 | 5 |

| 化合物番号 | 除 草 効 果 | | |
|-------|---------|-----|-----|
| | E c | M o | S c |
| I-279 | 4 | 5 | 5 |
| I-280 | 5 | 5 | 5 |
| I-281 | 5 | 5 | 5 |
| I-282 | 5 | 5 | 5 |
| I-283 | 5 | 5 | 5 |
| I-284 | 5 | 5 | 5 |
| I-285 | 5 | 5 | 5 |
| I-286 | 5 | 5 | 5 |
| I-287 | 5 | 5 | 5 |
| I-288 | 5 | 5 | 5 |
| I-289 | 5 | 5 | 5 |
| I-290 | 5 | 5 | 5 |
| I-291 | 5 | 5 | 5 |
| I-292 | 5 | 5 | 5 |
| I-293 | 5 | 5 | 5 |
| I-294 | 5 | 5 | 5 |
| I-295 | 4 | 5 | 5 |
| I-296 | 5 | 5 | 5 |
| I-297 | 5 | 5 | 5 |
| I-298 | 5 | 5 | 5 |
| I-299 | 5 | 5 | 5 |
| I-300 | 5 | 5 | 5 |
| I-301 | 4 | 5 | 5 |
| I-302 | 5 | 5 | 5 |
| I-303 | 5 | 5 | 5 |
| I-304 | 5 | 5 | 5 |
| I-305 | 5 | 5 | 5 |
| I-306 | 5 | 5 | 5 |
| I-307 | 5 | 5 | 5 |

【0154】

【表39】

【0153】

【表38】

| 化合物番号 | 除 草 効 果 | | |
|-------|---------|-----|-----|
| | E c | M o | S c |
| I-308 | 5 | 5 | 5 |
| I-309 | 5 | 5 | 5 |
| I-310 | 5 | 5 | 5 |
| I-311 | 5 | 5 | 5 |
| I-312 | 5 | 5 | 5 |
| I-313 | 4 | 5 | 5 |
| I-314 | 5 | 5 | 5 |
| I-315 | 5 | 5 | 5 |
| I-316 | 5 | 5 | 5 |
| I-317 | 5 | 5 | 5 |
| I-318 | 5 | 5 | 5 |
| I-319 | 5 | 5 | 5 |
| I-320 | 5 | 5 | 5 |
| I-321 | 5 | 5 | 5 |
| I-322 | 4 | 5 | 5 |
| I-323 | 5 | 5 | 5 |
| I-324 | 5 | 5 | 5 |
| I-325 | 5 | 5 | 5 |
| I-326 | 5 | 5 | 5 |
| I-327 | 5 | 5 | 5 |
| I-328 | 5 | 5 | 5 |
| I-329 | 4 | 5 | 5 |
| I-330 | 5 | 5 | 5 |
| I-331 | 5 | 5 | 5 |
| I-332 | 5 | 5 | 5 |
| I-333 | 5 | 5 | 5 |
| I-334 | 5 | 5 | 5 |
| I-335 | 5 | 5 | 5 |
| I-336 | 5 | 5 | 5 |

【0155】

【表40】

| 化合物番号 | 除 草 効 果 | | |
|-------|---------|-----|-----|
| | E c | M o | S c |
| I-337 | 5 | 5 | 5 |
| I-338 | 5 | 5 | 5 |
| I-339 | 5 | 5 | 5 |
| I-340 | 5 | 5 | 5 |
| I-341 | 5 | 5 | 5 |
| I-342 | 5 | 5 | 5 |
| I-343 | 5 | 5 | 5 |
| I-344 | 5 | 5 | 5 |
| I-345 | 5 | 5 | 5 |
| I-346 | 5 | 5 | 5 |
| I-347 | 5 | 5 | 5 |
| I-348 | 5 | 5 | 5 |
| I-349 | 5 | 5 | 5 |
| I-350 | 5 | 5 | 5 |
| I-351 | 5 | 5 | 5 |
| I-352 | 5 | 5 | 5 |
| I-353 | 5 | 5 | 5 |
| I-354 | 5 | 5 | 5 |
| I-355 | 5 | 5 | 5 |
| I-356 | 5 | 5 | 5 |
| I-357 | 5 | 5 | 5 |
| I-358 | 5 | 5 | 5 |
| I-359 | 5 | 5 | 5 |
| I-360 | 5 | 5 | 5 |
| I-361 | 5 | 5 | 5 |
| I-362 | 5 | 5 | 5 |
| I-363 | 5 | 5 | 5 |
| I-364 | 5 | 5 | 5 |
| I-365 | 5 | 5 | 5 |

【0156】

【表41】

| 化合物番号 | 除 草 効 果 | | |
|-------|---------|-----|-----|
| | E c | M o | S c |
| I-366 | 5 | 5 | 5 |
| I-367 | 5 | 5 | 5 |
| I-368 | 5 | 5 | 5 |
| I-369 | 5 | 5 | 5 |
| I-370 | 5 | 5 | 5 |
| I-371 | 5 | 5 | 5 |
| I-372 | 5 | 5 | 5 |
| I-492 | 5 | 5 | 5 |
| I-493 | 5 | 5 | 5 |
| I-494 | 5 | 5 | 5 |
| I-495 | 5 | 5 | 5 |
| I-496 | 5 | 5 | 5 |
| I-498 | 5 | 5 | 5 |
| I-499 | 5 | 5 | 5 |
| I-500 | 5 | 5 | 5 |
| I-501 | 5 | 5 | 5 |
| I-502 | 5 | 5 | 5 |
| I-503 | 5 | 5 | 5 |
| I-504 | 5 | 5 | 5 |
| I-505 | 5 | 5 | 5 |
| I-506 | 4 | 5 | 5 |
| I-507 | 5 | 5 | 5 |
| I-508 | 5 | 5 | 5 |
| I-509 | 5 | 5 | 5 |
| I-510 | 5 | 5 | 5 |
| I-511 | 5 | 5 | 5 |
| I-512 | 5 | 5 | 5 |
| I-513 | 5 | 5 | 5 |
| I-514 | 5 | 5 | 5 |

【0157】

【表42】

| 化合物番号 | 除 草 効 果 | | |
|-------|---------|-----|-----|
| | E c | M o | S c |
| I-515 | 2 | 5 | 5 |
| I-516 | 5 | 5 | 5 |
| I-517 | 5 | 5 | 5 |
| I-521 | 5 | 5 | 5 |
| I-522 | 5 | 5 | 5 |
| I-523 | 5 | 5 | 5 |
| I-524 | 5 | 5 | 5 |
| I-525 | 5 | 5 | 5 |
| I-526 | 5 | 5 | 5 |
| I-527 | 5 | 5 | 5 |
| I-528 | 5 | 5 | 5 |
| I-529 | 5 | 5 | 5 |
| I-530 | 5 | 5 | 5 |
| I-531 | 5 | 5 | 5 |
| I-532 | 5 | 5 | 5 |
| I-533 | 5 | 5 | 5 |
| I-534 | 5 | 5 | 5 |
| I-535 | 4 | 5 | 5 |
| I-536 | 5 | 5 | 5 |
| I-537 | 5 | 5 | 5 |
| I-538 | 5 | 5 | 5 |
| I-539 | 5 | 5 | 5 |
| I-540 | 5 | 5 | 5 |
| I-541 | 5 | 5 | 5 |
| I-542 | 5 | 5 | 5 |
| I-543 | 5 | 5 | 5 |
| I-544 | 5 | 5 | 5 |
| I-545 | 5 | 5 | 5 |
| I-546 | 5 | 5 | 5 |

【0158】

【表43】

| 化合物番号 | 除 草 効 果 | | |
|-------|---------|-----|-----|
| | E c | M o | S c |
| I-547 | 4 | 5 | 5 |
| I-548 | 5 | 5 | 5 |
| I-549 | 5 | 5 | 5 |
| I-550 | 5 | 5 | 5 |
| I-551 | 5 | 5 | 5 |
| I-552 | 5 | 5 | 5 |
| I-553 | 5 | 5 | 5 |
| I-554 | 5 | 5 | 5 |
| I-555 | 5 | 5 | 5 |
| I-556 | 5 | 5 | 5 |
| I-557 | 5 | 5 | 5 |
| I-558 | 5 | 5 | 5 |
| I-559 | 4 | 5 | 5 |
| I-560 | 5 | 5 | 5 |
| I-561 | 5 | 5 | 5 |
| I-562 | 5 | 5 | 5 |
| I-563 | 5 | 5 | 5 |
| I-564 | 5 | 5 | 5 |
| I-565 | 5 | 5 | 5 |
| I-566 | 5 | 5 | 5 |
| I-567 | 5 | 5 | 5 |
| I-568 | 5 | 5 | 5 |
| I1-45 | 5 | 5 | 5 |
| I1-55 | 4 | 5 | 5 |
| I1-56 | 4 | 5 | 5 |
| I1-57 | 5 | 5 | 5 |

【0159】〈試験例2〉 水田湛水処理による作物選択性試験

100cm²のプラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、コナギ(Mo)およびホタルイ(Sc)の各種子を0.5cmの深さに播種し、さらに2葉期の水稻(Or)を移植深度2cmで2本移植し、水深3cmに湛水した。翌日、製剤例1に準じて調製した水和剤の所定有効成分量(ai, g/10a)を水で希釈し、水面に滴下処理した。その後、温室内で育成し、処理後28日目に表36の基準に従って除草効果および薬害程度を調査した。結果を表44～表49に示す。

【0160】

【表44】

| 化合物 番 号 | 薬量 a i, g /10 a | 除 草 効 果 | | 薬 害 O r |
|------------|-----------------------|---------|-----|------------|
| | | M o | S c | |
| I- 1 | 1. 6 | 5 | 4 | 0 |
| I- 4 | 1. 6 | 5 | 4 | 0 |
| I- 7 | 1. 6 | 5 | 4 | 0 |
| I-253 | 1. 6 | 5 | 5 | 0 |
| I-257 | 1. 6 | 5 | 5 | 0 |
| I-258 | 6. 3 | 5 | 5 | 0 |
| I-259 | 1. 6 | 5 | - | 0 |
| I-260 | 6. 3 | 5 | 5 | 0 |
| I-262 | 6. 3 | 5 | 5 | 0 |
| I-263 | 6. 3 | 5 | 5 | 0 |
| I-264 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-265 | 1. 6 | 5 | 5 | 0 |
| I-266 | 1. 6 | 5 | - | 0 |
| I-268 | 1. 6 | 5 | 5 | 0 |
| I-269 | 0. 4 | 5 | 5 | 0 |
| I-271 | 1. 6 | 5 | - | 0 |
| I-272 | 1. 6 | - | 5 | 0 |
| I-273 | 1. 6 | 5 | 5 | 0 |
| I-274 | 1. 6 | 5 | - | 0 |
| I-275 | 1. 6 | 5 | 5 | 0 |
| I-276 | 1. 6 | 5 | 5 | 0 |
| I-278 | 1. 6 | 5 | 5 | 0 |
| I-280 | 1. 6 | - | 5 | 0 |
| I-281 | 1. 6 | - | 5 | 0 |
| I-282 | 1. 6 | 5 | 5 | 0 |
| I-283 | 1. 6 | - | 5 | 0 |
| I-285 | 1. 6 | - | 5 | 0 |
| I-286 | 6. 3 | - | 5 | 0 |

【0161】

【表45】

| 化合物 番 号 | 薬量 a i, g /10 a | 除 草 効 果 | | 害 害 O r |
|------------|-----------------------|---------|-----|------------|
| | | M o | S c | |
| I-287 | 1.6 | - | 5 | 0 |
| I-288 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-289 | 1.6 | - | 5 | 0 |
| I-290 | 1.6 | - | 5 | 0 |
| I-291 | 1.6 | - | 5 | 0 |
| I-293 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-294 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-295 | 25 | - | 5 | 0 |
| I-298 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-299 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-300 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-301 | 1.6 | - | 5 | 0 |
| I-302 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-303 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-304 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-305 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-306 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-307 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-309 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-311 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-312 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-313 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-314 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-315 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-316 | 1.6 | - | 5 | 0 |
| I-321 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-324 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-325 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-326 | 25 | 5 | 5 | 0 |

【0162】

【表46】

| 化合物 番 号 | 薬量 a i, g /10 a | 除 草 効 果 | | 薬 害 |
|------------|-----------------------|---------|-----|-----|
| | | M o | S c | O r |
| I-328 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-329 | 1.6 | - | 5 | 0 |
| I-330 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-331 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-332 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-333 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-334 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-335 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-337 | 1.6 | 5 | 4 | 0 |
| I-338 | 1.6 | 5 | 3 | 0 |
| I-339 | 6.3 | 5 | 5 | 1 |
| I-343 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-344 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-346 | 6.3 | 5 | 4 | 0 |
| I-347 | 1.6 | 5 | 4 | 0 |
| I-348 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-349 | 1.6 | 5 | 4 | 0 |
| I-352 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-353 | 25 | 4 | 5 | 0 |
| I-354 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-355 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-356 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-357 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-358 | 25 | 4 | 5 | 0 |
| I-359 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-360 | 100 | 5 | 5 | 1 |
| I-361 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| I-362 | 100 | 5 | 5 | 1 |
| I-363 | 100 | 5 | 5 | 0 |

【0163】

【表47】

| 化合物 番 号 | 薬量 a i, g /10 a | 除 草 効 果 | | 薬 害 |
|------------|-----------------------|---------|-----|-----|
| | | M o | S c | O r |
| I-364 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| I-365 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-366 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-367 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-368 | 100 | 5 | 5 | 1 |
| I-370 | 100 | 5 | 5 | 1 |
| I-371 | 100 | 5 | 5 | 1 |
| I-372 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| I-493 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-494 | 6.3 | - | 5 | 0 |
| I-495 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-496 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-498 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-499 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-500 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-501 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-502 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-503 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-504 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-505 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-506 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-507 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-508 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-509 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-510 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-511 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-512 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-513 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-514 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |

【0164】

【表48】

| 化合物 番 号 | 薬量 a i, g /10 a | 除 草 効 果 | | 薬 害 |
|------------|-----------------------|---------|-----|-----|
| | | M o | S c | O r |
| I-515 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| I-516 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-517 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-521 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-522 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-523 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| I-524 | 6.3 | 4 | 5 | 0 |
| I-525 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-526 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-527 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-528 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-529 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-530 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-531 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-532 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| I-533 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-534 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-535 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| I-536 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-537 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-538 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-539 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-540 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-541 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-542 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| I-543 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-544 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-546 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| I-550 | 1.6 | 4 | 5 | 0 |

【0165】

【表49】

| 化合物 番 号 | 薬量 a i, g / 10 a | 除 草 効 果 | | 薬 害 |
|------------|------------------------|---------|-----|-----|
| | | M o | S c | O r |
| 1-551 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-552 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| 1-553 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| 1-554 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-556 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-557 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| 1-558 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| 1-559 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| 1-560 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| 1-561 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| 1-562 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-563 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| 1-564 | 6.3 | 5 | 5 | 0 |
| 1-565 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| 1-566 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-567 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| 1-568 | 1.6 | 5 | 5 | 0 |
| 11-55 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 11-56 | 100 | 5 | 5 | 0 |
| 11-57 | 25 | 5 | 5 | 0 |

【0166】

【発明の効果】一般式〔1〕で表される本発明の化合物は、水田に発生するタイヌビエ、タマガヤツリ、コナギ、アゼナ等の一年生雑草及びヘラオモダカ、ホタルイ、ウリカワ、オモダカ、ミズガヤツリ、クログワイ等

の多年生雑草に対し、発生前から生育期の広い範囲にわたって、雑草の発生および生育を長期間抑制し、低薬量で防除することができる。一方、同時にイネに対して高い安全性を有するものである。

フロントページの続き

(51)Int. Cl.⁶

識別記号

F I

C 07 D 403/06

2 3 3

C 07 D 403/06

2 3 3

413/04

2 3 9

413/04

2 3 9

(72)発明者 鈴木 千治

静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1

株式会社ケイ・アイ研究所内

(72)発明者 小野 至正

静岡県静岡市敷地2丁目13番地の10

(72)発明者 井田 智久

静岡県小笠郡菊川町町加茂3353番地

(72)発明者 中谷 昌央

静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1

株式会社ケイ・アイ研究所内

(72)発明者 柳沢 克忠

静岡県小笠郡菊川町半済3061番地の88

(72)発明者 田丸 雅敏

静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1

株式会社ケイ・アイ研究所内

(72)発明者 佐土原 英雄

埼玉県新座市堀ノ内2丁目9番地の3